

玖、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於新穎的 N-炔基-2-烷硫基-2-(經取代之芳氧基和雜芳氧基)烷基醯胺類及其亞磺醯基和磺醯基衍生物。本發明亦關於製備彼等之方法、含彼等之組成物及使用彼等對抗真菌，尤其是植物真菌感染的方法。

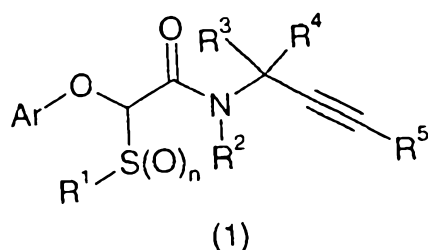
【先前技術】

某些 N-炔基-2-(經取代之苯氧基)烷基醯胺類係在 US 4,116,677 中說明可作為除草劑。其他則是在 US 4,168,319 中說明可作為除霉劑。有幾種 N-二甲基丙炔基- α -甲氧基-和 α -乙氧基- α -(經取代之苯氧基)乙醯胺類係在 US 4,062,977 中說明可供用作殺蟎劑，而化合物 N-二甲基丙炔基- α -甲氧基- α -(3,5-二甲基苯氧基)乙醯胺類係在 US 4,083,867 中說明可供用作除草劑。

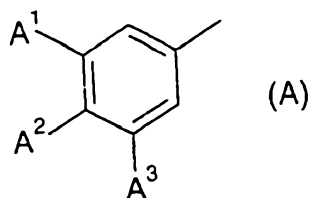
【發明內容】

本發明係關於提供主要作為植物殺真菌劑之特定 N-炔基-2-烷硫基-2-(經取代之芳氧基和雜芳氧基)烷基醯胺類及其亞磺醯基和磺醯基衍生物。

因此，本發明提供一種通式(1)之化合物：

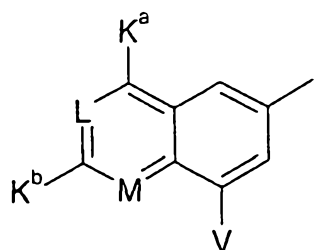


其中 Ar 是一種式(A)之基團：

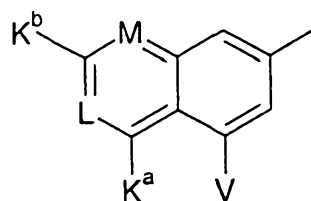


其中 A^1 、 A^2 和 A^3 係獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基（如甲基）、鹵素(C_{1-4})烷基（如三氟甲基）、 C_{2-4} 烯基、鹵素(C_{2-4})烯基、 C_{2-4} 炔基、鹵素(C_{2-4})炔基、 C_{1-4} 烷氧基（如甲氧基）、鹵素(C_{1-4})烷氧基（如三氟甲氧基）、 $-S(O)_m(C_{1-4})$ 烷基，其中 m 是 0、1 或 2 且烷基係視需要經鹵素取代（特別是氟，如甲硫基、三氟甲基磺醯基）， $-OSO_2(C_{1-4})$ 烷基，其中烷基係視需要經鹵素取代（特別是氟，如三氟甲基磺醯氧基），氟基、硝基、 C_{1-4} 烷氧羰基、 $-CONR^mR^n$ 、 $-COR^m$ 、 $-NR^mCOR^n$ 、 $-SO_2NR^mR^n$ 或 $-NR^mSO_2R^1$ ，其中 R^1 是 C_{1-4} 烷基，而 R^m 和 R^n 係獨立地為 H 或 C_{1-4} 烷基（如 $-NHCOCH_3$ ）；或者

Ar 是一種式 (B1) 或 (B2) 之基團：



(B1)



(B2)

其中 L 和 M 係獨立地為 N、N-氧化物或 CQ，但是 L 或 M 不超過一者是 N-氧化物；

K^a 和 K^b 係獨立地為 H 或 F；

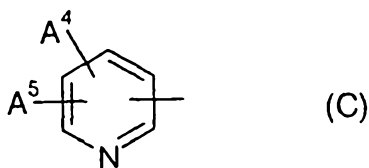
V 是：H，鹵素（如氟、氯、溴、碘），視需要經鹵素或 C_{1-4} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷基，視需要經鹵素或 C_{1-4} 烷氧

基取代之 C_{3-6} 環烷基，視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 烯基，視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 炔基，視需要經鹵素或 C_{1-4} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷氧基，視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 烯氧基（如烯丙氧基），視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 炔氧基（如炔丙氧基），氰基、硝基、 C_{1-4} 烷氧羰基、 $-OSO_2R'$ ； $-S(O)_mR'$ 、 $-COR''$ 、 $-CONR''R'''$ 、 $-SO_2NR''R'''$ 、 $-NR''SO_2R'$ 、 $-CR''=NR'''$ 、 $-NR''R'''$ 、 $-NR''COR'''$ 、 $-NR''CO_2R'''$ ，其中 m 是 0、1 或 2， R' 是視需要經鹵素取代之 C_{1-6} 烷基，而 R'' 和 R''' 係獨立地為 H 或 C_{1-6} 烷基，或者在 $-CONR''R'''$ 或 $-SO_2NR''R'''$ 的情況中，可結合形成一個含有一個氮原子、數個飽和碳原子和視需要之一個氧原子的 5 或 6 員環；

Q 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、鹵素(C_{1-8})烷基、鹵素(C_{1-8})烷氧基、鹵素(C_{1-8})烷硫基、硝基、胺基、單或二(C_{1-6})烷基胺基、單或二(C_{2-6})烯基胺基、單或二(C_{2-6})炔基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷氧羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺羰基、單或二(C_{1-4})烷基胺羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰氧基、芳基(C_{1-4})烷羰氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基磺醯氧基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基、 $-SO_2NR^mR^n$ 、 $-NR^mSO_2R^l$ ，其中 R^l 是視需要經鹵素取代之 C_{1-6} 烷基，而 R^m 和 R^n 係獨立地為 H 或視需要經鹵素取代之 C_{1-6} 烷基，或者，在 $-SO_2NR^mR^n$ 的情況中，可結合形成一個含有一個氮原

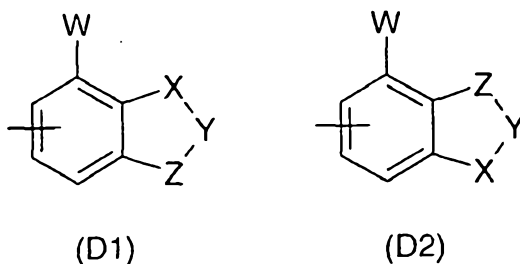
子、數個飽和碳原子和視需要之一個氧原子的 5 或 6 員環；或者

Ar 是一種式 (C) 之基團：



其中 A^4 和 A^5 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、硝基、胺基、單或二 (C_{1-6}) 烷基胺基、單或二 (C_{2-6}) 烯基胺基、單或二 (C_{2-6}) 炔基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基 (甲醯基) 胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷基 (C_{1-4} 烷羰基) 胺基、氧基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺羰基、單或二 (C_{1-4}) 烷基胺羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰氧基、芳基 (C_{1-4}) 烷羰氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯氧基、芳基、雜芳基、芳氧基、芳硫基、雜芳氧基或雜芳硫基，其中前述之烷基、環烷基、烯基、炔基、芳基或雜芳基等基團或部分係視需要經取代；或者

Ar 是一種式 (D1) 或 (D2) 之 5-或 6-連接基：



其中 W 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素 (C_{1-4}) 烷基

、鹵素(C_{1-4})烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基、氟基或硝基，

X 是 N、NH 或 $N-C_{1-4}$ 烷基，

Y 是 CR、N、NH、 $N-C_{1-4}$ 烷基、O 或 S，

Z 是 CR、N、NH、 $N-C_{1-4}$ 烷基、O 或 S，

R 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基或鹵素(C_{1-4})烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基或單或二(C_{1-6})烷基胺基，結合 X、Y、Z 和稠合苯環的鍵結為適合 X、Y 和 Z 價數的雙鍵或單鍵，但前提是 Y 和 Z 中只有一個可為 O 或 S，Y 和 Z 中只有一個可為 CH 或 CR，以及 X、Y 和 Z 中只有一個可為 NH 或 $N-C_{1-4}$ 烷基；

R^1 是甲基或乙基；

R^2 是 H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部分的苯環係視需要經 C_{1-4} 烷氧基取代；

R^3 和 R^4 係獨立地為 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，但前提是二者不同時為 H，且當二者都不是 H 時，它們的總合碳數不超過 4，或者

R^3 和 R^4 與它們所連接的碳原子結合形成一個 3 或 4 員碳環族環，其視需要含有一個 O、S 或 N 原子且視需要鹵素或 C_{1-4} 烷基取代；

R^5 是：H， C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中該烷基或環烷基係視需要經鹵素、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、氟基、 C_{1-4} 烷羰氧

基、胺基羰氧基或單或二(C₁₋₄)烷胺基羰氧基取代，-S(O)_p(C₁₋₆)烷基，其中 p 是 0、1 或 2，三唑基（如 1,2,4-三唑-1-基），吡唑基，咪唑基，三(C₁₋₄)-烷基-甲矽烷氧基，視需要經取代之苯氧基，視需要經取代之噻吩氧基，視需要經取代之苄氧基或視需要經取代之噻吩甲氧基，或者

R⁵ 是視需要經取代之苯基、視需要經取代之噻吩基或視需要經取代之苄基，

其中該 R⁵ 等值物之視需要經取代之苯基和噻吩基環或部分係視需要經一、二或三個選自於下列之取代基取代：鹵素、羥基、巰基、C₁₋₄ 烷基、C₂₋₄ 烯基、C₂₋₄ 炔基、C₁₋₄ 烷氧基、C₂₋₄ 烯氧基、C₂₋₄ 炔氧基、鹵素(C₁₋₄)烷基、鹵素(C₁₋₄)烷氧基、-S(O)_m(C₁₋₄)烷基（其中 m 是 0、1 或 2 且該烷基係視需要經鹵素取代），羥基(C₁₋₄)烷基、C₁₋₄ 烷氧基(C₁₋₄)烷基、C₃₋₆ 環烷基、C₃₋₆ 環烷基(C₁₋₄)烷基、苯氧基、苄氧基、苯甲醯氧基、氰基、異氰基、硫氰基、異硫氰基、硝基、-NR^pR^q、-NHCOR^p、-NHCONR^pR^q、-CONR^pR^q、-SO₂NR^pR^q、-NR^pSO₂R^o、-SO₂R^o、-OSO₂R^o、-COR^p、-CR^p=NR^q 或 -N=CR^pR^q，其中 R^o 是 C₁₋₄ 烷基、鹵素(C₁₋₄)烷基、C₁₋₄ 烷氧基、鹵素(C₁₋₄)烷氧基、C₁₋₄ 烷硫基、C₃₋₆ 環烷基、C₃₋₆ 環烷基(C₁₋₄)烷基、苯基或苄基，該苯基和苄基係視需要經鹵素、C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 烷氧基取代，而 R^p 和 R^q 係獨立地為氫、C₁₋₄ 烷基、鹵素(C₁₋₄)烷基、C₁₋₄ 烷氧基、鹵素(C₁₋₄)烷氧基、C₁₋₄ 烷硫基、C₃₋₆ 環烷基、C₃₋₆ 環烷基(C₁₋₄)烷基、苯基或

苄基，該苯基和苄基係視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代；以及

n 是 0、1 或 2。

為避免疑義，在式 (A)、(B1)、(B2)、(C)、(D1) 和 (D2) 基團中所示之未連接單鍵係指式 (1) 化合物中 Ar 基團與分子其餘部分的連接點。在式 (D1) 與 (D2) 基團中之未連接浮動鍵結情況中，基團 (D1) 或 (D2) 係連接在其 5- 或 6- 位任一者。

本發明之化合物含有至少一個不對稱碳原子（以及當 R^3 和 R^4 不同時則至少二個）且可以對映異構體（或以數對非對映異構體）或此等之混合物存在。此外，當 n 是 1 時，本發明之化合物為亞砷類，其可以二種對映異構體形式存在，且相鄰碳亦可以二種對映異構體形式存在。通式 (1) 之化合物因此可以外消旋物、非對映異構體或單一對映異構體存在，且本發明包括所有比例之所有可能的異構體或異構體混合物。可預期的是，對於任何既有化合物而言，一種異構體可比另一種更具有殺真菌活性。

除了另外敘述者，烷基和烷氧基、烷硫基等的烷基部分，宜以直鏈或支鏈形式含有 1 至 6 個，典型 1 至 4 個碳原子。實例有：甲基，乙基，正與異丙基及正、第二、異和第三丁基。當烷基部分含有 5 或 6 碳原子時，實例為正戊基和正己基。烷基和烷基部分的適當可選用取代基的例子包括鹵素、羥基、 C_{1-4} 烷氧基和 C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷氧基、視需要經取代之芳基及視需要經取代之雜芳基。當可選

用的取代基為鹵素時，該鹵烷基或鹵烷基部分通常是三氟甲基或三氟甲基。

除了另外敘述者，烯基和炔基部分亦宜以直鏈或支鏈形式含有 2 至 6 個，典型 2 至 4 個碳原子。實例有烯丙基、乙炔基及炔丙基。可選用的取代基包括鹵素。

鹵素包括氟、氯、溴和碘。最普遍地說，是氟、氯或溴，而通常是氟或氯。

芳基通常是苯基，但亦包括萘基、蒽基和菲基。雜芳基典型而言是含有一或多個 O、N 或 S 雜原子的 5 或 6 員芳族環，其可被稠合至一或多個其他芳族或雜芳族環，例如苯環上。實例有：噻吩基、呋喃基、吡咯基、異吡唑基、吡唑基、噻唑基、噻二唑基、吡唑基、咪唑基、三唑基、異噻唑基、四唑基、噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、嗒嗪基、三嗪基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、二苯并呋喃基、苯并噻唑基、苯并吡唑基、苯并咪唑基、吲哚基、喹啉基及喹喏啉基，以及適當時，其 N-氧化物和鹽類。芳基或雜芳基等值物任一者係視需要經取代。除了另外敘述者之外，可存在的取代基包括下列之一或多者：鹵素，羥基，巰基， C_{1-8} 烷基（尤其是甲基和乙基）， C_{2-6} 烯基（尤其是烯丙基）， C_{2-6} 炔基（尤其是炔丙基）， C_{1-6} 烷氧基（尤其是甲氧基）， C_{2-6} 烯氧基（尤其是烯丙氧基）， C_{2-6} 炔氧基（尤其是炔丙氧基），鹵素(C_{1-8})烷基（尤其是三氟甲基），鹵素(C_{1-6})烷氧基（尤其是三氟甲氧基）， C_{1-6} 烷硫基（尤其是甲硫基），羥基(C_{1-6})烷基， C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})

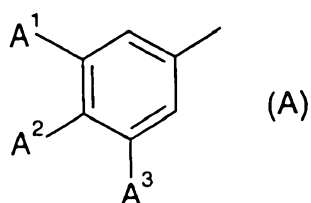
烷基， C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷氧基， C_{3-6} 環烷基， C_{3-6} 環烷基
 (C_{1-4}) 烷基，視需要經取代之芳基（尤其是視需要經取代之
 苯基），視需要經取代之雜芳基（尤其是視需要經取代之
 吡啶基或嘧啶基），視需要經取代之芳氧基（尤其是視需
 要經取代之苯氧基），視需要經取代之雜芳氧基（尤其是
 視需要經取代之吡啶氧基或嘧啶氧基），視需要經取代之
 芳硫基（尤其是視需要經取代之苯硫基），視需要經取代之
 雜芳硫基（尤其是視需要經取代之吡啶硫基或嘧啶硫基
 ），視需要經取代之芳基 (C_{1-4}) 烷基（尤其是視需要經取代之
 苄基、視需要經取代之苯乙基和視需要經取代之苯正丙
 基），其中烷基部分係視需要經羥基取代；視需要經取代之
 雜芳基 (C_{1-4}) 烷基（尤其是視需要經取代之吡啶基 (C_{1-4})
 烷基或嘧啶基 (C_{1-4}) 烷基），視需要經取代之芳基 (C_{2-4}) 烯
 基（尤其是視需要經取代之苯乙烯基），視需要經取代之
 雜芳基 (C_{2-4}) 烯基（尤其是視需要經取代之吡啶乙烯基或嘧
 啶乙烯基），視需要經取代之芳基 (C_{1-4}) 烷氧基（尤其是視
 需要經取代之苄氧基和苯乙氧基），視需要經取代之雜芳
 基 (C_{1-4}) 烷氧基（尤其是視需要經取代之吡啶基 (C_{1-4}) 烷氧
 基或嘧啶基 (C_{1-4}) 烷氧基），視需要經取代之芳氧基 (C_{1-4})
 烷基（尤其是苯氧基甲基），視需要經取代之雜芳氧基
 (C_{1-4}) 烷基（尤其是視需要經取代之吡啶氧基或嘧啶氧基
 (C_{1-4}) 烷基），視需要經取代之芳基 (C_{1-4}) 烷硫基（尤其是
 視需要經取代之苄硫基和苯乙硫基），視需要經取代之雜
 芳基 (C_{1-4}) 烷硫基（尤其是視需要經取代之吡啶基或嘧啶基

(C_{1-4})烷硫基)，視需要經取代之芳硫基(C_{1-4})烷基(尤其是苯硫基甲基)，視需要經取代之雜芳硫基(C_{1-4})烷基(尤其是視需要經取代之吡啶硫基或嘓啶硫基(C_{1-4})烷基)，醃氧基，包括 C_{1-4} 烷醃氧基(尤其是乙醃氧基)和苯甲醃氧基，氟基，異氟基，硫氟基、異硫氟基、硝基、 $-NR^sR^t$ 、 $-NHCOR^s$ 、 $-NHCONR^sR^t$ 、 $-CONR^sR^t$ 、 $-COOR^s$ 、 $-SO_2R^r$ 、 $-OSO_2R^r$ 、 $-COR^s$ 、 $-CR^s=NR^t$ 或 $-N=CR^sR^t$ ，其中 R^r 是 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，該苯基和苄基係視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代，而 R^s 和 R^t 係獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，該苯基和苄基係視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代。

可存在於前述任一取代基之芳基或雜芳基環中的取代基包括下列之一或多者：鹵素，羥基，巰基， C_{1-4} 烷基， C_{2-4} 烯基， C_{2-4} 炔基， C_{1-4} 烷氧基， C_{2-4} 烯氧基， C_{2-4} 炔氧基，鹵素(C_{1-4})烷基，鹵素(C_{1-4})烷氧基， C_{1-4} 烷硫基，鹵素(C_{1-4})烷硫基，羥基(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基， C_{3-6} 環烷基， C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基，烷醃氧基，苯氧基，苄氧基，苯甲醃氧基，氟基，異氟基，硫氟基、異硫氟基、硝基、 $-NR^sR^t$ 、 $-NHCOR^s$ 、 $-NHCONR^sR^t$ 、 $-CONR^sR^t$ 、 $-COOR^s$ 、 $-SO_2R^r$ 、 $-OSO_2R^r$ 、 $-COR^s$ 、 $-CR^s=NR^t$ 或 $-N=CR^sR^t$ ，其中 R^r 、 R^s 和 R^t 具有以上所給之意義。在式(A)基團之苯環上的取代

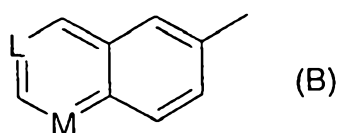
基 A^1 、 A^2 和 A^3 可提供一個經 3-、3,5-或 3,4,5-取代的苯環。

特別感興趣的是其中 Ar 為式 (A) 基團的化合物：



其中 A^1 、 A^2 和 A^3 係獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基（如甲基）、鹵素(C_{1-4})烷基（如三氟甲基）、 C_{2-4} 烯基、鹵素(C_{2-4})烯基、 C_{2-4} 炔基、鹵素(C_{2-4})炔基、 C_{1-4} 烷氧基（如甲氧基）、鹵素(C_{1-4})烷氧基（如三氟甲氧基）、 $-S(O)_m(C_{1-4})$ 烷基，其中 m 是 0、1 或 2 且烷基係視需要經氟取代（如甲硫基、三氟甲基磺醯基）， $-OSO_2(C_{1-4})$ 烷基，其中烷基係視需要經氟取代（如三氟甲基磺醯氧基），氰基、硝基、 C_{1-4} 烷氧羰基、 $-CONR^mR^n$ 、 $-COR^m$ 或 $-NR^mCOR^n$ ，其中 R^m 和 R^n 係獨立地為 H 或 C_{1-4} 烷基（如 $-NHCOCH_3$ ）；或者

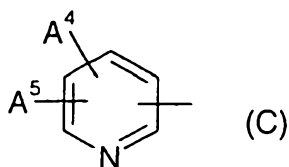
Ar 是式 (B) 之基團者：



其中 L 和 M 其中之一為 N，而另一者為 CQ，或 L 和 M 二者都是 N；Q 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、鹵素(C_{1-8})烷基、鹵素(C_{1-8})烷氧基、硝基、胺基、單或二(C_{1-6})烷基胺基、單或二(C_{2-6})烯基胺基、單或二(C_{2-6})炔基胺基、甲醯胺基

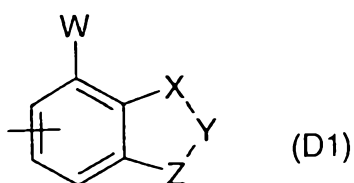
、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺羰基、單或二(C_{1-4})烷基胺羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰氧基、芳基(C_{1-4})烷羰氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基磺醯氧基；或者

Ar 是式(C)之基團者：



其中 A^4 和 A^5 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、硝基、胺基、單或二(C_{1-6})烷基胺基、單或二(C_{2-6})烯基胺基、單或二(C_{2-6})炔基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺羰基、單或二(C_{1-4})烷基胺羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰氧基、芳基(C_{1-4})烷羰氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯氧基、芳基、雜芳基、芳氧基、芳硫基、雜芳氧基或雜芳硫基，其中前述之烷基、環烷基、烯基、炔基、芳基或雜芳基等基團或部分係視需要經取代；或者

Ar 是式(D1)之基團者：



其中 W 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素 (C_{1-4}) 烷基或鹵素 (C_{1-4}) 烷氧基，

X 是 N、NH 或 $N-C_{1-4}$ 烷基，

Y 是 CH、N、NH、O 或 S，

Z 是 CH、N、NH、 $N-C_{1-4}$ 烷基、O 或 S，以及

結合 X、Y、Z 和稠合苯環的鍵結為適合 X、Y 和 Z 價數的雙鍵或單鍵，但前提是 Y 和 Z 中只有一個可為 O 或 S，Y 和 Z 中只有一個可為 CH，以及 X、Y 和 Z 中只有一個可為 NH 或 $N-C_{1-4}$ 烷基；

R^1 是甲基或乙基；

R^2 是 H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部分的苯環係視需要經 C_{1-4} 烷氧基取代；

R^3 和 R^4 係獨立地為 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，但前提是二者不同時為 H，且當二者都不是 H 時，它們的總合碳數不超過 4，或者

R^3 和 R^4 與它們所連接的碳原子結合形成一個 3 或 4 員碳環族環，其視需要含有一個 O、S 或 N 原子且視需要鹵素或 C_{1-4} 烷基取代；

R^5 是：H， C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中該烷基或環烷基係視需要經鹵素、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 烷羰氧基、胺基羰氧基或單或二 (C_{1-4}) 烷胺基羰氧基取代；三 (C_{1-4})-烷基-甲矽烷氧基，視需要經取代之苯氧基，視需要經取代之噻吩氧基，視需要經取代之苄氧基或視需要經取代之噻吩甲氧基，或者

R^5 是視需要經取代之苯基、視需要經取代之噻吩基或視需要經取代之芞基，

其中該 R^5 等值物之視需要經取代之苯基和噻吩基環係視需要經一、二或三個選自於下列之取代基取代：鹵素、羥基、巰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{2-4} 烯氧基、 C_{2-4} 炔氧基、鹵素(C_{1-4})烷基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、羥基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯氧基、芞氧基、苯甲醯氧基、氰基、異氰基、硫氰基、異硫氰基、硝基、 $-NR^pR^q$ 、 $-NHCOR^p$ 、 $-NHCONR^pR^q$ 、 $-CONR^pR^q$ 、 $-SO_2R^p$ 、 $-OSO_2R^p$ 、 $-COR^p$ 、 $-CR^p=NR^q$ 或 $-N=CR^pR^q$ ，其中 R^p 和 R^q 係獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或芞基，該苯基和芞基係視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代；以及

n 是 0、1 或 2。

當 Ar 是一種式(A)之基團時，典型而言， A^1 、 A^2 和 A^3 都是氯或甲基；或者 A^1 和 A^3 二者為氯、溴或氟，而 A^2 是 H 或甲基；或者 A^1 和 A^3 二者為甲基或甲氧基，而 A^2 是 H、氯、溴或烷硫基；或者 A^1 是甲氧基， A^2 是 H，而 A^3 是氰基或氯；或者 A^1 是甲基， A^2 是 H，而 A^3 是乙基；或者 A^1 是氯、溴、三氟甲基、三氟甲氧基或乙醯基，而 A^2 和 A^3 二者為 H；或者 A^1 和 A^3 二者為 H，而 A^2 是氯或溴；或者 A^1 是甲基， A^2 是烷硫基，而 A^3 是 H。

當 Ar 是一種式(A)之基團時，尤其重要的是下列情況：
 : A^1 、 A^2 和 A^3 都是氯或甲基；或者 A^1 和 A^3 二者為氯或溴，而 A^2 是 H 或甲基；或者 A^1 和 A^3 二者為甲基或甲氧基，而 A^2 是 H、氯、溴或烷硫基；或者 A^1 是甲氧基， A^2 是 H，而 A^3 是氰基或氯；或者 A^1 是甲基， A^2 是 H，而 A^3 是乙基；或者 A^1 是氯、溴或三氯甲基，而 A^2 和 A^3 二者為 H。

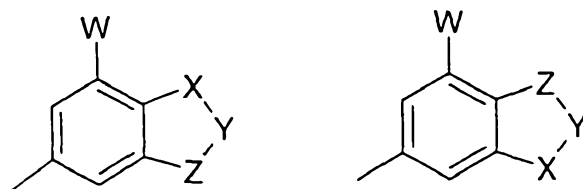
當 Ar 是一種式(B1)或(B2)之基團時，特別重要的是其中 M 是 N 且 L 是 CQ 的化合物（喹啉）及其中 L 和 M 二者都是 N 的化合物（喹啉啞）。亦重要的是其中 L 是 N 且 M 是 CQ 的化合物（異喹啉）及其中 L 和 M 二者都是 CQ 的化合物（蔡基）。Q 典型而言是 H 或鹵素，例如溴。

當 Ar 是一種式(B)之基團時，尤其重要的是其中 M 是 N 且 L 是 CQ 的化合物（喹啉）及其中 L 和 M 二者都是 N 的化合物（喹啉啞）。亦重要的是其中 L 是 N 且 M 是 CQ 的化合物（異喹啉）。Q 典型而言是 H 或鹵素，例如溴。

當 Ar 是一種式(C)之吡啶基團時，通式(1)化合物中之烷酸醯胺側鏈可連接至 2-、3-或 4-位上的吡啶環。較佳的是，其係連接至 3-或 4-位，而更佳的是連接至 3-位。典型而言，在式(C)基團中， A^4 是 H，而 A^5 是鹵素、 C_{1-4} 烷基、環丙基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、硝基、胺基、單或二(C_{1-4})烷基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺羰基、單或二(C_{1-4})烷基胺羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰氧基、苯基

(C_{1-4}) 烷羰氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯氧基、苯基、雜芳基、苯氧基、苯硫基、雜芳氧基或雜芳硫基，其中前述之烷基、環烷基、烯基或炔基等基團或部分係視需要經鹵素、羥基或 C_{1-4} 烷氧基取代，而前述之苯基或雜芳基等基團或部分係視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、硝基或氰基取代，且雜芳基是呋喃基、噻吩基、吡啶基或嘓啶基。 C_{1-4} 烷羰胺基的一個例子是甲羰胺基，而經取代之 C_{1-4} 烷基磺醯氧基的一個例子是三氟甲基磺醯氧基。

當 Ar 是一種式 (D1) 或 (D2) 之基團時，特別重要的是下式於所示位置連接的基團：



其中 W 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4}) 烷基、鹵素(C_{1-4}) 烷氧基、鹵素(C_{1-4}) 烷硫基、鹵素(C_{1-4}) 烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4}) 烷基磺醯基、氰基或硝基，以及

(1) X 是 N，Y 是 CR，Z 是 O、S、NH 或 N- C_{1-4} 烷基，且 R 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4}) 烷基或鹵素(C_{1-4}) 烷氧基、鹵素(C_{1-4}) 烷硫基、鹵素(C_{1-4}) 烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4}) 烷基磺醯基或單或二(C_{1-6}) 烷基胺基，X-Y 鍵為雙鍵，而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵；或

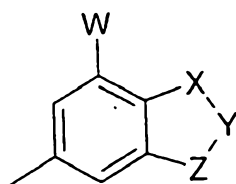
者

(2) X 和 Y 是 N，且 Z 是 O、S、NH 或 N-C₁₋₄ 烷基，X-Y 鍵為雙鍵，而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵；或者

(3) X 是 N，Y 是 O、S、NH 或 N-C₁₋₄ 烷基，Z 是 CR，且 R 是 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 烷硫基、C₁₋₄ 烷基亞磺醯基、C₁₋₄ 烷基磺醯基、鹵素(C₁₋₄)烷基或鹵素(C₁₋₄)烷氧基、鹵素(C₁₋₄)烷硫基、鹵素(C₁₋₄)烷基亞磺醯基、鹵素(C₁₋₄)烷基磺醯基或單或二(C₁₋₆)烷基胺基，X-Y 鍵和 Y-Z 鍵為單鍵，而將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為雙鍵；或者

(4) X 是 NH 或 N-C₁₋₄ 烷基，Y 是 N，Z 是 CR，且 R 是 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 烷硫基、C₁₋₄ 烷基亞磺醯基、C₁₋₄ 烷基磺醯基、鹵素(C₁₋₄)烷基或鹵素(C₁₋₄)烷氧基、鹵素(C₁₋₄)烷硫基、鹵素(C₁₋₄)烷基亞磺醯基、鹵素(C₁₋₄)烷基磺醯基或單或二(C₁₋₆)烷基胺基，Y-Z 鍵為雙鍵，而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵。

當 Ar 是一種式(D1)之基團時，尤其重要的是下式於所示位置連接的基團：



其中 W 是 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、鹵素(C₁₋₄)烷基或鹵素(C₁₋₄)烷氧基；以及

(1) X 是 N, Y 是 CH, Z 是 O、S、NH 或 N-C₁₋₄ 烷基, X-Y 鍵為雙鍵, 而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵; 或者

(2) X 和 Y 是 N, Z 是 O、S、NH 或 N-C₁₋₄ 烷基, X-Y 鍵為雙鍵, 而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵; 或者

(3) X 是 N, Y 是 O、S 或 NH, Z 是 CH, X-Y 和 Y-Z 鍵為單鍵, 而將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為雙鍵; 或者

(4) X 是 NH、N-C₁₋₄ 烷基, Y 是 N, Z 是 CH, Y-Z 鍵為雙鍵, 而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵。

式(D1)與(D2)基團的例子有: 視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-和 6-苯并噻唑基, 視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-和 6-(2,1-苯并異噻唑基), 視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-和 6-苯并噁唑基, 視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-和 6-(2,1-苯并異噁唑基), 視需要帶有一個 2-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-苯并咪唑基), 視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-噁唑基), 視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(2H-噁唑基), 5-和 6-(1,2,3-苯并噻二唑基), 5-和 6-(1,2,3-苯并噁二唑基), 視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-苯并三唑基), 視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(2H-苯并三唑基), 5-(2,1,3-苯并噻二唑基) 及 5-(2,1,3-苯并噁二唑基), 其中前述視需要選用的取代

基任一者係選自於鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基或鹵素(C_{1-4})烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基或單或二(C_{1-4})烷基胺基。

當 Ar 是一種式(D1)之基團時，特別重要的是其中(D1)係選自於下列各基所組成群組的化合物：5-和 6-苯并噻唑基，5-和 6-(2,1-苯并異噻唑基)，5-和 6-苯并噁唑基，5-和 6-(2,1-苯并異噁唑基)，視需要帶有一個 $N-C_{1-4}$ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-苯并咪唑基)，視需要帶有一個 $N-C_{1-4}$ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-吡唑基)，5-和 6-(2H-吡唑基)，5-和 6-(1,2,3-苯并噻二唑基)，5-和 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)，視需要帶有一個 $N-C_{1-4}$ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-苯并三唑基)，5-(2H-苯并三唑基)，5-(2,1,3-苯并噻二唑基)及 5-(2,1,3-苯并噁二唑基)。

當 Ar 是一種式(D1)或(D2)之基團時，更加特別重要的是其中(D1)或(D2)為以下基團的化合物：視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-或 6-苯并噻唑基，視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-(2,1-苯并異噻唑基)，視需要帶有一個 2-C 取代基之 6-苯并噁唑基，視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-(2,1-苯并異噁唑基)，視需要帶有一個 2-C 取代基且視需要帶有一個 $N-C_{1-4}$ 烷基取代基之 6-(1H-苯并咪唑基)，視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 $N-C_{1-4}$ 烷基取代基之 5-(1H-吡唑基)，6-(1,2,3-苯并噻二唑基)或 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)，其中前述視需要選用的取代基任

一者係選自於鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基或鹵素(C_{1-4})烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基或單或二(C_{1-4})烷基胺基。

當 Ar 是一種式(D1)之基團時，甚至更重要的是其中(D1)為下列各基的化合物：5-或 6-苯并噻唑基，5-(2,1-苯并異噻唑基)，6-苯并噁唑基，5-(2,1-苯并異噁唑基)，視需要帶有一個 $N-C_{1-4}$ 烷基取代基之 6-(1H-苯并咪唑基)，視需要帶有一個 $N-C_{1-4}$ 烷基取代基之 5-(1H-吡唑基)，6-(1,2,3-苯并噻二唑基)或 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)。

尤其重要的是其中(D1)或(D2)為以下基團的化合物：視需要帶有一個 2-C 取代基之 6-苯并噁唑基或視需要帶有一個 2-C 取代基之 6-苯并噻唑基，特別是後者，其中前述視需要選用的取代基任一者係選自於鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基或鹵素(C_{1-4})烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基或單或二(C_{1-4})烷基胺基。

甚至更重要的是其中(D1)為 6-苯并噁唑基或 6-苯并噻唑基，特別是後者的化合物。

R^1 是甲基或乙基。

典型而言， R^2 是 H，而 R^3 和 R^4 中至少一者，但較佳二者都是甲基。當 R^3 和 R^4 之一是 H 時，另一者可為甲基、乙基或正或異丙基。當 R^3 和 R^4 之一是甲基時，另一者可為 H

或乙基，但較佳也是甲基。R² 亦包括 C₁₋₄ 烷氧基甲基和苄氧基甲基，其中苄基的苯環視需要載有一個烷氧基取代基，例如甲氧基取代基。R² 的這類等值物提供被認為是前體農藥化合物的式(1)化合物。

典型而言，R⁵ 是 H 或甲基，較佳為甲基。然而，亦特別重要的是其中 R⁵ 為羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、對氟苯基、間乙醯基苯基、2-噻吩基、3-噻吩基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基的化合物，尤其是其中 R⁵ 為羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者。

一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 係如前文所定義者；R¹ 是甲基或乙基；R² 是 H；R³ 和 R⁴ 二者為甲基；R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、對氟苯基、間乙醯基苯基、2-噻吩基、3-噻吩基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者；以及 n 是 0、1 或 2，通常為 0。較佳而言，R⁵ 是甲基或甲氧基甲基。

另一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是一種式(A)之基團，其中 A¹、A² 和 A³ 都是氟或甲基，或者 A¹ 和 A³ 二者為氟、溴或氯，而 A² 是 H 或甲基，或者 A¹ 和 A³ 二者為甲基或甲氧基，而 A² 是 H、氟、溴或烷硫基

，或者 A^1 是甲氧基， A^2 是 H，而 A^3 是氰基或氯，或者 A^1 是甲基， A^2 是 H，而 A^3 是乙基，或者 A^1 是氯、溴、三氟甲基、三氟甲氧基或乙酰基，而 A^2 和 A^3 二者為 H，或者 A^1 和 A^3 二者為 H，而 A^2 是氯或溴，或者 A^1 是甲基， A^2 是烷硫基，而 A^3 是 H； R^1 是甲基或乙基； R^2 是 H； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氰基正丙基、3-氯正丙基、苯基、4-氯苯基、3-乙酰基苯基、噁吩-2-基、噁吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氰基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者；以及 n 是 0、1 或 2，通常為 0。較佳而言， R^5 是甲基或甲氧基甲基。

又另一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是一種式(A)之基團，其中 A^1 、 A^2 和 A^3 都是氯或甲基，或者 A^1 和 A^3 二者為氯或溴，特別是氯，而 A^2 是 H 或甲基，或者 A^1 和 A^3 二者為甲基或甲氧基，而 A^2 是 H、氯、溴或烷硫基，或者 A^1 是甲氧基， A^2 是 H，而 A^3 是氰基或氯，或者 A^1 是甲基， A^2 是 H，而 A^3 是乙基，或者 A^1 是氯、溴或三氟甲基，而 A^2 和 A^3 二者為 H； R^1 是甲基或乙基； R^2 是 H； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氰基正丙基、3-氯正丙基、苯基、4-氯苯基、3-乙酰基苯基、噁吩-2-基、噁吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氰基正丙基及第三丁

基二甲基甲矽烷氧基甲基者；以及 n 是 0、1 或 2，通常為 0。較佳而言， R^5 是甲基或甲氧基甲基。

更進一步方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是一種式(B1)或(B2)之基團，其中 L 和 M 係獨立地為 N、N-氧化物或 CQ，但是 L 或 M 中不超過一者是 N-氧化物；Q 是氫或鹵素（例如溴）； R^1 是甲基或乙基； R^2 是 H； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、4-氟苯基、3-乙醯基苯基、噻吩-2-基、噻吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者；以及 n 是 0、1 或 2，通常為 0。較佳而言， R^5 是甲基或甲氧基甲基。

又另一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是一種式(B)之基團，其中 L 和 M 之一是 N，另一者是 CQ，或者 L 和 M 二者都是 N；Q 是氫或鹵素（例如溴）； R^1 是甲基或乙基； R^2 是 H； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、4-氟苯基、3-乙醯基苯基、噻吩-2-基、噻吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者；以及 n 是 0、1 或 2，通常為 0。較佳而言， R^5 是甲基或甲氧基甲基。

更進一步方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是一種式(C)之基團，其中 A⁴ 是 H，而 A⁵ 是鹵素、C₁₋₄ 烷基、環丙基、C₂₋₄ 烯基、C₂₋₄ 炔基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 烷硫基、硝基、胺基、單或二(C₁₋₄)烷基胺基、甲醯胺基、C₁₋₄ 烷基(甲醯基)胺基、C₁₋₄ 烷羰基胺基、C₁₋₄ 烷基(C₁₋₄ 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、C₁₋₄ 烷羰基、C₁₋₄ 烷氧羰基、胺羰基、單或二(C₁₋₄)烷基胺羰基、羧基、C₁₋₄ 烷羰氧基、苯基(C₁₋₄)烷羰氧基、C₁₋₄ 烷基亞磺醯基、C₁₋₄ 烷基磺醯基、C₁₋₄ 烷基磺醯氧基、苯基、雜芳基、苯氧基、苯硫基、雜芳氧基或雜芳硫基，其中前述 A⁵ 所可為之烷基、環烷基、烯基或炔基等基團或部分任一者係視需要經鹵素、羥基或 C₁₋₄ 烷氧基取代；前述 A⁵ 所可為之苯基或雜芳基等基團或部分係視需要經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、硝基或氰基取代；雜芳基是呋喃基、噁吩基、吡啶基或嘧啶基；R¹ 是甲基或乙基；R² 是 H；R³ 和 R⁴ 二者為甲基；R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯基正丙基、苯基、4-氟苯基、3-乙醯基苯基、噁吩-2-基、噁吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者；以及 n 是 0、1 或 2，通常為 0。較佳而言，R⁵ 是甲基或甲氧基甲基。進一步較佳者為烷酸醯胺側鏈係於 3-位連接至式(C)基團之吡啶環。

又另一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中

Ar 是一種式(C)之基團，其中 A^4 是 H、 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基或 CN； A^5 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或鹵素(C_{1-4})烷基； R^1 是甲基或乙基； R^2 是 H； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氟正丙基、苯基、4-氟苯基、3-乙酰基苯基、噻吩-2-基、噻吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者，最好是甲基或甲氧基甲基；n 是 0、1 或 2，通常是 0；以及烷酸醯胺側鏈係連接至吡啶環之 3-位。

又另一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是一種式(C)之基團，其中 A^4 是 H、 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基或 CN； A^5 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或鹵素(C_{1-4})烷基； R^1 是甲基或乙基； R^2 是 H； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氟正丙基、苯基、4-氟苯基、3-乙酰基苯基、噻吩-2-基、噻吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者，最好是甲基或甲氧基甲基；n 是 0、1 或 2，通常是 0；以及烷酸醯胺側鏈係連接至吡啶環之 4-位。

還有另一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-或 6-苯并噻唑基、視需要帶有一個 3-C 取代基之 5- (2,1-苯并異噻唑基)

、視需要帶有一個 2-C 取代基之 6-苯并噁唑基、視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-(2,1-苯并異噁唑基)、視需要帶有一個 2-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 6-(1H-苯并咪唑基)、視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-(1H-吡啶基)、6-(1,2,3-苯并噻二唑基)或 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)，其中前述視需要選用的取代基任一者係選自於鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 烷硫基、C₁₋₄ 烷基亞磺醯基、C₁₋₄ 烷基磺醯基、鹵素(C₁₋₄)烷基或鹵素(C₁₋₄)烷氧基、鹵素(C₁₋₄)烷硫基、鹵素(C₁₋₄)烷基亞磺醯基、鹵素(C₁₋₄)烷基磺醯基或單或二(C₁₋₄)烷基胺基；R¹ 是甲基或乙基；R² 是 H；R³ 和 R⁴ 二者為甲基；R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯基正丙基、苯基、4-氟苯基、3-乙醯基苯基、噻吩-2-基、噻吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者。較佳而言，R⁵ 是甲基或甲氧基甲基。

又另一方面，本發明提供一種通式(1)之化合物，其中 Ar 是 5-或 6-苯并噻唑基、5-(2,1-苯并異噻唑基)、6-苯并噁唑基、5-(2,1-苯并異噁唑基)、視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 6-(1H-苯并咪唑基)、視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-(1H-吡啶基)、6-(1,2,3-苯并噻二唑基)或 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)；R¹ 是甲基或乙基；R² 是 H；R³ 和 R⁴ 二者為甲基；且 R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基

甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、4-氟苯基、3-乙酰基苯基、噻吩-2-基、噻吩-3-基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基，尤其是當 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基及第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基者。較佳而言， R^5 是甲基或甲氧基甲基。

構成本發明部分之化合物係例示於下表 1 至 129 中。特徵數據係列於實施例之後的表 130 中。

表 1

表 1 中之化合物是通式 (1) 中 Ar 是一種式 (A) 之基團，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是 H， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是甲基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表中所列之值者。

化合物編號	A^1	A^2	A^3
1	Cl	Cl	CN
2	Cl	Cl	Cl
3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4	Cl	H	Cl
5	Cl	CH ₃	Cl
6	Br	H	Br
7	Br	CH ₃	Br
8	CH ₃	H	CH ₃
9	CH ₃	Cl	CH ₃
10	CH ₃	Br	CH ₃
11	CH ₃	CH ₃ S	CH ₃
12	CH ₃ O	H	CH ₃ O
13	CH ₃ O	Cl	CH ₃ O
14	CH ₃ O	Br	CH ₃ O
15	CH ₃ O	CH ₃ S	CH ₃ O
16	CH ₃ O	H	CN
17	CH ₃ O	H	Cl
18	CH ₃	H	C ₂ H ₅
19	Cl	H	H
20	Br	H	H
21	CF ₃	H	H
22	H	Cl	H
23	H	Br	H
24	H	F	H

25	H	CN	H
26	H	CF ₃ O	H
27	H	CH ₃ S	H
28	H	HC=C-	H
29	H	CH ₂ =CH-	H
30	H	CH ₃ O	H
31	H	COCH ₃	H
32	H	CF ₃	H
33	F	H	H
34	CN	H	H
35	CH ₃	H	H
36	CH ₃ CO	H	H
37	CH ₃ O	H	H
38	CF ₃ O	H	H
39	CH ₃ S	H	H
40	HC=C-	H	H
41	CH ₂ =CH-	H	H
42	F	H	F
43	F	H	Cl
44	F	H	Br
45	F	H	CH ₃ O
46	F	H	CH ₃ CO
47	F	H	CN
48	F	H	CH ₃
49	F	H	CF ₃ O
50	F	H	CF ₃
51	F	H	CH ₃ S
52	F	H	COOCH ₃
53	Cl	H	Br
54	Cl	H	CH ₃ CO
55	Cl	H	CH ₃
56	Cl	H	CN
57	Cl	H	CF ₃ O
58	Cl	H	CF ₃
59	Cl	H	CH ₃ S
60	Cl	H	COOCH ₃
61	Cl	H	CON(CH ₃) ₂
62	Cl	H	NHCOOCH ₃
63	Cl	H	OSO ₂ CH ₃
64	Cl	H	HC=C-
65	Cl	H	CH ₂ =CH-
66	Br	H	CH ₃
67	Br	H	CN
68	CN	H	CN
69	CN	H	CH ₃
70	CN	H	CF ₃ O
71	CF ₃ O	H	CF ₃ O
72	CF ₃	H	CF ₃
73	CH ₃	H	CH ₃ O
74	F	F	H

75	F	Cl	H
76	F	Br	H
77	F	CH ₃ O	H
78	F	CN	H
79	F	CH ₃	H
80	Cl	Cl	H
81	Cl	F	H
82	Cl	Br	H
83	Cl	CN	H
84	Cl	CH ₃	H
85	Cl	CH ₃ O	H
86	Cl	CF ₃ O	H
87	Cl	CH ₃ S	H
88	Cl	CH ₃ SO ₂ O	H
89	Cl	CH ₃ CO	H
90	CN	F	H
91	CN	Cl	H
92	CN	CH ₃ O	H
93	CH ₃ O	CH ₃ O	H
94	CH ₃ O	Cl	H
95	CH ₃ O	CN	H
96	CH ₃ CO	Cl	H
97	CF ₃ O	Cl	H
98	CF ₃ O	CN	H
99	CH ₃ S	Cl	H
100	CH ₃ S	F	H
101	CH ₃ S	CH ₃	H
102	CH ₃ SO ₂ O	Cl	H
103	Cl	Cl	F
104	Cl	Cl	Br
105	Cl	Cl	CH ₃ O
106	Cl	Cl	CH ₃ CO
107	Cl	Cl	CH ₃ S
108	Cl	F	Cl
109	Cl	CH ₃ O	Cl
110	Cl	CF ₃ O	Cl
111	Cl	CH ₃ SO	Cl
112	Cl	CH ₃ SO ₂	Cl
113	Cl	OSO ₂ CH ₃	Cl
114	Cl	CH ₃ CO	Cl
115	Cl	CO ₂ CH ₃	Cl
116	Cl	CON(CH ₃) ₂	Cl
117	Cl	HC=C-	Cl
118	Cl	CH ₂ =CH-	Cl
119	Cl	NHCO ₂ CH ₃	Cl
120	F	F	F
121	F	F	CN
122	F	F	CH ₃
123	F	F	CH ₃ O
124	F	CH ₃ O	F

125	F	CF ₃ O	F
126	F	CH ₃ SO	F
127	F	CH ₃ SO ₂	F
128	F	OSO ₂ CH ₃	F
129	F	CH ₃ CO	F
130	F	CO ₂ CH ₃	F
131	CH ₃ O	CH ₃ O	CH ₃ O
132	CH ₃ O	CH ₃ O	Cl
133	CH ₃ O	CH ₃ O	CH ₃
134	Cl	CN	Cl
135	CH ₃	CH ₃ S	H
136	C ₆ H ₅ O	H	H

表 2

表 2 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團，n 是 0，R¹ 是乙基，R² 是氫，R³ 和 R⁴ 二者為甲基，R⁵ 是甲基且 A¹、A² 和 A³ 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 2 之化合物 1 中的 R¹ 是乙基而不是甲基之外，表 2 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 2 之化合物中的 R¹ 是乙基而不是甲基之外，表 2 之化合物 2 至 136 係分別與表 1 之化合物 2 至 136 相同。

表 3

表 3 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團，n 是 0，R¹ 是甲基，R² 是氫，R³ 和 R⁴ 二者為甲基，R⁵ 是 H 且 A¹、A² 和 A³ 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 3 之化合物 1 中的 R⁵ 是 H 而不是甲基之外，表 3 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 3 之化合物中的 R⁵ 是 H 而不是甲基之外之外，表 3 之化合物 2 至 136 係分別與表 1 之化合物 2 至 136 相同。

表 4

表 4 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種

式(A)之基團， n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是 H 且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 4 之化合物 1 中的 R^5 是 H 而不是甲基之外，表 4 之化合物 1 係與表 2 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 4 之化合物中的 R^5 是 H 而不是甲基之外，表 4 之化合物 2 至 136 係分別與表 2 之化合物 2 至 136 相同。

表 5

表 5 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是羥甲基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 5 之化合物 1 中的 R^5 是羥甲基而不是甲基之外，表 5 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 5 之化合物中的 R^5 是羥甲基而不是甲基之外，表 5 之化合物 2 至 136 係分別與表 1 之化合物 2 至 136 相同。

表 6

表 6 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團， n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是羥甲基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 6 之化合物 1 中的 R^5 是羥甲基而不是甲基之外，表 6 之化合物 1 係與表 2 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 6 之化合物中的 R^5 是羥甲基而不是甲基之外，表 6 之化合物 2 至 136 係分別與表 2 之化合物 2 至 136 相同。

表 7

表 7 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種

式(A)之基團， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是甲氧基甲基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 7 之化合物 1 中的 R^5 是甲氧基甲基而不是甲基之外，表 7 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 7 之化合物中的 R^5 是甲氧基甲基而不是甲基之外，表 7 之化合物 2 至 136 係分別與表 1 之化合物 2 至 136 相同。

表 8

表 8 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團， n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是甲氧基甲基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 8 之化合物 1 中的 R^5 是甲氧基甲基而不是甲基之外，表 8 之化合物 1 係與表 2 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 8 之化合物中的 R^5 是甲氧基甲基而不是甲基之外，表 8 之化合物 2 至 136 係分別與表 2 之化合物 2 至 136 相同。

表 9

表 9 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 9 之化合物 1 中的 R^5 是第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基而不是甲基之外，表 9 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 9 之化合物中的 R^5 是第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基而不是

甲基之外，表 9 之化合物 2 至 136 係分別與表 1 之化合物 2 至 136 相同。

表 10

表 10 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團，n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 10 之化合物 1 中的 R^5 是第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基而不是甲基之外，表 10 之化合物 1 係與表 2 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 10 之化合物中的 R^5 是第三丁基二甲基甲矽烷氧基甲基而不是甲基之外，表 10 之化合物 2 至 136 係分別與表 2 之化合物 2 至 136 相同。

表 11

表 11 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是 1-甲氧基乙基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 11 之化合物 1 中的 R^5 是 1-甲氧基乙基而不是甲基之外，表 11 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 11 之化合物中的 R^5 是 1-甲氧基乙基而不是甲基之外，表 11 之化合物 2 至 136 係分別與表 1 之化合物 2 至 136 相同。

表 12

表 12 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團，n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為

甲基， R^5 是 1-甲氧基乙基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 12 之化合物 1 中的 R^5 是 1-甲氧基乙基而不是甲基之外，表 12 之化合物 1 係與表 2 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 12 之化合物中的 R^5 是 1-甲氧基乙基而不是甲基之外，表 12 之化合物 2 至 136 係分別與表 2 之化合物 2 至 136 相同。

表 13

表 13 係由 136 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(A)之基團， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基， R^5 是 3-氯基丙基且 A^1 、 A^2 和 A^3 具有表 1 中所列之值。因此，除了表 13 之化合物 1 中的 R^5 是 3-氯基丙基而不是甲基之外，表 13 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 13 之化合物中的 R^5 是 3-氯基丙基而不是甲基之外，表 13 之化合物 2 至 136 係分別與表 1 之化合物 2 至 136 相同。

表 14

表 14 中之化合物是通式(1)中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 N，L 是 CH， K^a 、 K^b 和 V 是 H， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是 H， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表中所列之值者。

化合物編號	R^5
1	H
2	CH ₃
3	C ₂ H ₅
4	<i>n</i> -C ₃ H ₇
5	<i>i</i> -C ₃ H ₇
6	<i>n</i> -C ₄ H ₉
7	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
8	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
9	<i>tert</i> -C ₄ H ₉
10	HOCH ₂

11	HOC ₂ H ₄
12	CH ₃ OCH ₂
13	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
14	C ₂ H ₅ OCH ₂
15	CH ₃ (CH ₂ O)CH
16	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
17	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
18	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
19	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
20	NC-C ₂ H ₄
21	NC- <i>n</i> -C ₃ H ₆
22	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
23	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
24	2-氟基-環丙-1-基
25	4-氟基-環己-1-基
26	C ₆ H ₅ OCH ₂
27	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
28	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
29	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
30	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
31	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
32	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
33	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
34	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
35	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
36	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
37	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ OCH ₂
38	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
39	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
40	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
41	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
42	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ OCH ₂
43	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
44	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
45	噻吩-2-基-OCH ₂
46	噻吩-3-基-OCH ₂
47	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
48	噻吩-2-基-CH ₂ OCH ₂
49	噻吩-3-基-CH ₂ OCH ₂
50	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
51	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
52	C ₆ H ₅
53	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
54	4-F-C ₆ H ₄
55	4-Cl-C ₆ H ₄
56	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
57	4-Br-C ₆ H ₄
58	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
59	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃

60	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
61	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
62	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅
63	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
64	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
65	2-Br-C ₆ H ₄
66	2-Cl-C ₆ H ₄
67	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
68	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
69	3-Cl-C ₆ H ₄
70	噻吩-2-基
71	噻吩-3-基
72	C ₆ H ₅ CH ₂
73	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ CH ₂
74	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂
75	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
76	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
77	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
78	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
79	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
80	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
81	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
82	4-CF ₃ O-C ₆ H ₃ CH ₂
83	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
84	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
85	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
86	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
87	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
88	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
89	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
90	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆

表 15

表 15 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 N，L 是 CH，K^a、K^b 和 V 是 H，n 是 0，R¹ 是乙基，R² 是氫，R³ 和 R⁴ 二者為甲基且 R⁵ 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 15 之化合物 1 中的 R¹ 是乙基而不是甲基之外，表 15 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 15 之化合物中的 R¹ 是乙基而不是甲基之外，表 15 之化合物 2 至 90 係分別與表 14 之化合物 2

至 90 相同。

表 16

表 16 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，L 和 M 二者為 N， K^a 、 K^b 和 V 是 H，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 16 之化合物 1 中的 L 是 N 而不是 CH 之外，表 16 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 15 之化合物中的 L 是 N 而不是 CH 之外，表 16 之化合物 2 至 90 係分別與表 14 之化合物 2 至 90 相同。

表 17

表 17 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，L 和 M 二者為 N， K^a 、 K^b 和 V 是 H，n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 17 之化合物 1 中的 L 是 N 而不是 CH 之外，表 16 之化合物 1 係與表 15 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 17 之化合物中的 L 是 N 而不是 CH 之外，表 17 之化合物 2 至 90 係分別與表 15 之化合物 2 至 90 相同。

表 18

表 18 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 CH，L 是 N， K^a 、 K^b 和 V 是 H，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 18 之化合物 1 中的 L 是 N 而不是

CH 且 M 是 CH 而不是 N 之外，表 18 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 18 之化合物中的 L 是 N 而不是 CH 且 M 是 CH 而不是 N 之外，表 18 之化合物 2 至 90 係分別與表 14 之化合物 2 至 90 相同。

表 19

表 19 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 CH，L 是 N， K^a 、 K^b 和 V 是 H，n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 19 之化合物 1 中的 L 是 N 而不是 CH 且 M 是 CH 而不是 N 之外，表 19 之化合物 1 係與表 15 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 19 之化合物中的 L 是 N 而不是 CH 且 M 是 CH 而不是 N 之外，表 19 之化合物 2 至 90 係分別與表 15 之化合物 2 至 90 相同。

表 20

表 20 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 N，L 是 C-Br， K^a 、 K^b 和 V 是 H，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 20 之化合物 1 中的 L 是 C-Br 而不是 CH 之外，表 20 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 20 之化合物中的 L 是 C-Br 而不是 CH 之外，表 20 之化合物 2 至 90 係分別與表 14 之化合物 2 至 90 相同。

表 21

表 21 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種

式(B1)之基團，M是N，L是C-Br， K^a 、 K^b 和V是H，n是0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表14中所列之值。因此，除了表21之化合物1中的L是C-Br而不是CH之外，表21之化合物1係與表15之化合物1相同。同樣地，除了表21之化合物中的L是C-Br而不是CH之外，表21之化合物2至90係分別與表15之化合物2至90相同。

表 22

表22係由90個通式(1)之化合物所組成，其中Ar是一種式(B1)之基團，M是N，L是C-F， K^a 、 K^b 和V是H，n是0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表14中所列之值。因此，除了表22之化合物1中的L是C-F而不是CH之外，表22之化合物1係與表14之化合物1相同。同樣地，除了表22之化合物中的L是C-F而不是CH之外，表22之化合物2至90係分別與表14之化合物2至90相同。

表 23

表23係由90個通式(1)之化合物所組成，其中Ar是一種式(B1)之基團，M是N，L是C-Cl， K^a 、 K^b 和V是H，n是0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表14中所列之值。因此，除了表23之化合物1中的L是C-Cl而不是CH之外，表23之化合物1係與表14之化合物1相同。同樣地，除了表23之化合物中的L是C-Cl而不是CH之外，表23之化合物2至90係分別與表14之化合物2至

90 相同。

表 24

表 24 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 N，L 是 CH， K^a 和 K^b 是 H，V 是 Br，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 24 之化合物 1 中的 V 是 Br 而不是 H 之外，表 24 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 24 之化合物中的 V 是 Br 而不是 H 之外，表 24 之化合物 2 至 90 係分別與表 14 之化合物 2 至 90 相同。

表 25

表 25 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 N，L 是 C-Br， K^a 和 K^b 是 H，V 是 Cl，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 25 之化合物 1 中的 V 是 Cl 而不是 H 之外，表 25 之化合物 1 係與表 21 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 25 之化合物中的 V 是 Cl 而不是 H 之外，表 25 之化合物 2 至 90 係分別與表 21 之化合物 2 至 90 相同。

表 26

表 26 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 N，L 是 C-Br， K^a 和 K^b 是 H，V 是 Br，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 26 之化合物 1 中的 V 是

Br 而不是 H 之外，表 26 之化合物 1 係與表 21 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 26 之化合物中的 V 是 Br 而不是 H 之外，表 26 之化合物 2 至 90 係分別與表 21 之化合物 2 至 90 相同。

表 27

表 27 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B2)之基團，M 是 N，L 是 CH， K^a 、 K^b 和 V 是 H，n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 27 之化合物 1 中的 Ar 是(B2)而不是(B1)之外，表 27 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 15 之化合物中的 Ar 是(B2)而不是(B1)之外，表 27 之化合物 2 至 90 係分別與表 14 之化合物 2 至 90 相同。

表 28

表 28 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種式(B1)之基團，M 是 CH，L 是 C-Br， K^a 、 K^b 和 V 是 H，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 28 之化合物 1 中的 M 是 CH 而不是 N 之外，表 28 之化合物 1 係與表 20 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 28 之化合物中的 M 是 CH 而不是 N 之外，表 28 之化合物 2 至 90 係分別與表 20 之化合物 2 至 90 相同。

表 29

表 29 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是一種

式(B1)之基團，M是N，L是C-Cl， K^a 、 K^b 和V是H，n是0， R^1 是甲基， R^2 是乙氧基甲基， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表14中所列之值。因此，除了表29之化合物1中的 R^2 是乙氧基甲基而不是H之外，表29之化合物1係與表23之化合物1相同。同樣地，除了表29之化合物中的 R^2 是乙氧基甲基而不是H之外，表29之化合物2至90係分別與表23之化合物2至90相同。

表 30

表30係由90個通式(1)之化合物所組成，其中Ar是一種式(B1)之基團，M是N，L是C-F， K^a 、 K^b 和V是H，n是0， R^1 是甲基， R^2 是苄氧基甲基， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表14中所列之值。因此，除了表30之化合物1中的 R^2 是苄氧基甲基而不是H之外，表30之化合物1係與表22之化合物1相同。同樣地，除了表30之化合物中的 R^2 是苄氧基甲基而不是H之外，表30之化合物2至90係分別與表22之化合物2至90相同。

表 31

表31中之化合物是通式(1)中Ar是一種式(C)之基團，n是0且 A^4 、 A^5 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 具有表中所列之值者。烷酸醯胺側鏈係連接至式(C)基團中之吡啶環的3-位上(稱為3-吡啶)。

化合物編號	A^4	A^5	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5
1	H	5-Cl	C_2H_5	H	CH_3	CH_3	C_2H_5
2	H	5-Cl	CH_3	H	CH_3	CH_3	H
3	H	5-Cl	CH_3	H	CH_3	CH_3	CH_3
4	H	5-Cl	C_2H_5	H	CH_3	CH_3	H
5	H	5-Cl	C_2H_5	H	CH_3	CH_3	CH_3

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
6	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
7	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
8	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
9	6-CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
10	6-CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
11	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
12	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
13	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
14	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
15	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
16	H	5-CO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
17	H	5-CO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
18	H	5-CO ₂ H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
19	H	5-CO ₂ H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
20	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
21	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	環丙基
22	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	環丙基
23	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
24	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
25	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
26	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
27	H	5-Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
28	H	5-Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
29	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
30	H	5-Cl	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
31	H	5-Cl	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
32	H	5-Cl	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
33	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
34	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
35	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH=C H ₂	CH ₃	H
36	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH=C H ₂	CH ₃	CH ₃
37	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=C H ₂	CH ₃	H
38	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=C H ₂	CH ₃	CH ₃
39	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH=C H ₂	CH ₃	C ₂ H ₅
40	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=C H ₂	CH ₃	C ₂ H ₅
41	6-CH ₃	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
42	6-CH ₃	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
43	6-CH ₃	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
44	6-CH ₃	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
45	6-CH ₃	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
46	6-CH ₃	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
47	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
48	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
49	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
50	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
51	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
52	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
53	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
54	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
55	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
56	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
57	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OSi(CH ₃) ₂ (<i>t</i> -C ₄ H ₉)
58	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OSi(CH ₃) ₂ (<i>t</i> -C ₄ H ₉)
59	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	環丙基
60	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	環丙基
61	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OSi(CH ₃) ₂ (<i>t</i> -C ₄ H ₉)
62	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OSi(CH ₃) ₂ (<i>t</i> -C ₄ H ₉)
63	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
64	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
65	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OCH ₃
66	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OCH ₃
67	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃	H
68	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃
69	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CF ₃	H
70	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃
71	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃	C ₂ H ₅
72	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CF ₃	C ₂ H ₅
73	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	H
74	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	CH ₃
75	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	H
76	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	CH ₃
77	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
78	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
79	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	環丙基
80	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	環丙基
81	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	CH ₂ CF ₃
82	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	CH ₂ CF ₃
83	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	CH ₂ OCH ₃
84	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	環丙基
85	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	環丙基
86	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	CH ₂ CF ₃
87	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	CH ₂ CF ₃
88	H	5-Cl	CH ₃	H		CH ₂ CH ₂	CH ₂ OCH ₃
89	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H		CH ₂ CH ₂	CH ₂ OCH ₃
90	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
91	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
92	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
93	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
94	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
95	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
96	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
97	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
98	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
99	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
100	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
101	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
102	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
103	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
104	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
105	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
106	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
107	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
108	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
109	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
110	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
111	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
112	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
113	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
114	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
115	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
116	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
117	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
118	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
119	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
120	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
121	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
122	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
123	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
124	H	5-COCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
125	H	5-COCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
126	H	5-COCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
127	H	5-COCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
128	H	5-COCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
129	H	5-COCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
130	H	5-CN	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
131	H	5-CN	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
132	H	5-CN	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
133	H	5-CN	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
134	H	5-CN	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
135	H	5-CN	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
136	H	5-C≡CH	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
137	H	5-C≡CH	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
138	H	5-C≡CH	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
139	H	5-C≡CH	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
140	H	5- CH=CH ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
141	H	5- CH=CH ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
142	H	5- CH=CH ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
143	H	5- CH=CH ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
144	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
145	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
146	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH(OCH ₃)CH ₃
147	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH(OCH ₃)CH ₃
148	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -CN
149	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -CN
150	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
151	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
152	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
153	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
154	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉
155	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂
156	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOC ₂ H ₄
157	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂
158	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
159	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅ OCH ₂
160	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ (CH ₃ O)CH
161	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
162	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
163	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
164	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
165	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC-C ₂ H ₄
166	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₃ H ₆
167	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
168	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
169	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-氟基-環丙-1-基
170	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-氟基-環己-1-基
171	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OCH ₂
172	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
173	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
174	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
175	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
176	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
177	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
178	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
179	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
180	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
181	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
182	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
183	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
184	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
185	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
186	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
187	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ OCH ₂
188	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
189	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
190	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-OCH ₂
191	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-OCH ₂
192	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
193	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-CH ₂ OCH ₂
194	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-CH ₂ OCH ₂
195	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
196	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
197	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
198	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
199	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
200	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
201	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
202	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
203	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
204	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
205	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
206	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
207	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅
208	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
209	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
210	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
211	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
212	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
213	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
214	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
215	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基
216	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基
217	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
218	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ CH ₂
219	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂
220	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
221	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
222	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
223	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
224	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
225	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
226	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
227	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂
228	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
229	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
230	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
231	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
232	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
233	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
234	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
235	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆
236	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
237	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
238	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
239	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
240	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉
241	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂
242	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOC ₂ H ₄
243	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
244	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
245	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
246	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
247	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
248	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC-C ₂ H ₄
249	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₃ H ₆
250	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
251	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
252	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-氟基-環丙-1-基
253	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-氟基-環己-1-基
254	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OCH ₂
255	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
256	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
257	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
258	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
259	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
260	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
261	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
262	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
263	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
264	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
265	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
266	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
267	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
268	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
269	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
270	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ OCH ₂
271	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
272	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
273	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-OCH ₂
274	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-OCH ₂
275	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
276	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-CH ₂ OCH ₂
277	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-CH ₂ OCH ₂
278	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
279	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
280	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
281	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
282	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
283	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
284	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
285	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
286	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
287	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
288	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
289	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅
290	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
291	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
292	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
293	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
294	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
295	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
296	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
297	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基
298	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基
299	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
300	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ CH ₂
301	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂
302	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
303	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
304	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
305	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
306	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
307	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
308	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
309	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₃ CH ₂
310	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
311	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
312	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
313	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
314	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
315	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
316	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
317	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆
318	化合物編號 2 之 N-氧化物						
319	化合物編號 3 之 N-氧化物						
320	化合物編號 5 之 N-氧化物						

表 32

表 32 中之化合物是通式 (1) 中 Ar 是一種式 (C) 之基團，n 是 0 且 A⁴、A⁵、R¹、R²、R³、R⁴ 及 R⁵ 具有表中所列之值者。烷酸醯胺側鏈係連接至式 (C) 基團中之吡啶環的 4-位上 (稱為 4-吡啶)。

化合物 編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
1	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2	H	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
4	H	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
5	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
6	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
7	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
8	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
9	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
10	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
11	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
12	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
13	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
14	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
15	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
16	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
17	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
18	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
19	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
20	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -CN
21	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -Cl

22	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
23	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	環丙基
24	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
25	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -CN
26	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -Cl
27	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
28	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	環丙基
29	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
30	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
31	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
32	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
33	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
34	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉
35	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂
36	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOC ₂ H ₄
37	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂
38	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
39	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅ OCH ₂
40	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ (CH ₂ O)CH
41	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
42	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
43	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
44	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
45	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC-C ₂ H ₄
46	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
47	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
48	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-氟基-環丙-1-基
49	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-氟基-環己-1-基
50	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OCH ₂
51	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
52	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
53	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
54	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
55	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
56	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
57	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
58	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
59	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
60	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
61	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ OCH ₂
62	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
63	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
64	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
65	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
66	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ OCH ₂
67	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
68	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
69	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-OCH ₂
70	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-OCH ₂

71	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
72	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-CH ₂ OCH ₂
73	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-CH ₂ OCH ₂
74	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
75	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
76	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
77	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
78	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
79	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
80	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
81	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
82	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
83	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
84	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
85	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
86	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅
87	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
88	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
89	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
90	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
91	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
92	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
93	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
94	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基
95	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基
96	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
97	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ CH ₂
98	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂
99	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
100	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
101	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
102	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
103	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
104	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
105	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
106	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ CH ₂
107	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
108	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
109	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
110	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
111	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
112	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
113	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
114	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆
115	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
116	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
117	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
118	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
119	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉

120	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂
121	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOC ₂ H ₄
122	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂
123	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
124	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅ OCH ₂
125	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ (CH ₃ O)CH
126	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
127	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
128	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
129	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
130	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC-C ₂ H ₄
131	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
132	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
133	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-氟基-環丙-1-基
134	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-氟基-環己-1-基
135	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OCH ₂
136	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
137	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
138	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
139	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
140	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
141	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
142	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
143	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
144	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
145	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
146	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
147	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
148	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
149	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
150	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
151	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ OCH ₂
152	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
153	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
154	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-OCH ₂
155	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-OCH ₂
156	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
157	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基-CH ₂ OCH ₂
158	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基-CH ₂ OCH ₂
159	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
160	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>tert</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
161	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
162	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
163	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
164	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
165	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
166	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
167	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
168	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃

169	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
170	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
171	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₃
172	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
173	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
174	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
175	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
176	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
177	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
178	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
179	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-2-基
180	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	噻吩-3-基
181	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
182	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ CH ₂
183	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂
184	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
185	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
186	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
187	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
188	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
189	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
190	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
191	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₃ CH ₂
192	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
193	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
194	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
195	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
196	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
197	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
198	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
199	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆
200	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	環丙基

表 33

表 33 中之化合物是通式(1)中 Ar 是一種式(C)之基團，n 是 0 且 A⁴、A⁵、R¹、R²、R³、R⁴ 及 R⁵ 具有表中所列之值者。烷酸鹽胺側鏈係連接至式(C)基團中之吡啶環的 2-位上(稱為 2-吡啶)。

化合物編號	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
1	H	4-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃

2	H	4-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3	H	4-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
4	H	4-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
5	H	4-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
6	H	4-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
7	4-Cl	6-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
8	4-Cl	6-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
9	4-Cl	6-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
10	4-Cl	6-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
11	4-Cl	6-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
12	4-Cl	6-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
13	H	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
14	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
15	H	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
16	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
17	3-CN	6-CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
18	3-CN	6-CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
19	3-CN	6-CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
20	3-CN	6-CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
21	4-CF ₃	6-CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
22	4-CF ₃	6-CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
23	4-CF ₃	6-CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
24	4-CF ₃	6-CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H

表 34

表 34 中之化合物是通式(1)中 Ar 是 6-苯并噻唑基 (一種式(D1)之基團)，n 是 0，R¹ 是甲基，R² 是 H，R³ 和 R⁴ 二者為甲基且 R⁵ 具有表 14 中所列之值者。因此，表 34 中有 90 個化合物，化合物編號 1 具有與表 14 中化合物編號 1 相同的 R⁵ 值，化合物編號 2 具有與表 14 中化合物編號 2 相同的 R⁵ 值，以此類推。

表 35

表 35 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 6-苯并噻唑基，n 是 0，R¹ 是乙基，R² 是氫，R³ 和 R⁴ 二者為甲基且 R⁵ 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 35 之化合物 1 中的 R¹ 是乙基而不是甲基之外，表 35 之化合物 1 係與表

34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 35 之化合物中的 R^1 是乙基而不是甲基之外，表 35 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 36

表 36 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 5-苯并噻唑基，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 36 之化合物 1 中的 Ar 是 5-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 36 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 36 之化合物中的 Ar 是 5-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 36 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 37

表 37 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 5-苯并噻唑基，n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 37 之化合物 1 中的 Ar 是 5-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 37 之化合物 1 係與表 35 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 37 之化合物中的 Ar 是 5-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 37 之化合物 2 至 90 係分別與表 35 之化合物 2 至 90 相同。

表 38

表 38 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 6-苯并噻唑基，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲

基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 38 之化合物 1 中的 Ar 是 6-苯并噶唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 38 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 38 之化合物中的 Ar 是 6-苯并噶唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 38 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 39

表 39 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 6-苯并噶唑基， n 是 0， R^1 是乙基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 39 之化合物 1 中的 Ar 是 6-苯并噶唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 39 之化合物 1 係與表 35 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 39 之化合物中的 Ar 是 6-苯并噶唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 39 之化合物 2 至 90 係分別與表 35 之化合物 2 至 90 相同。

表 40

表 40 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 5-苯并異噶唑基， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 40 之化合物 1 中的 Ar 是 5-苯并異噶唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 40 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 40 之化合物中的 Ar 是 5-苯并異噶唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 40 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 41

表 41 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 5-(2,1,3-苯并噁二唑基)，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 41 之化合物 1 中的 Ar 是 5-(2,1,3-苯并噁二唑基)而不是 6-苯并噻唑基之外，表 41 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 41 之化合物中的 Ar 是 5-(2,1,3-苯并噁二唑基)而不是 6-苯并噻唑基之外，表 41 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 42

表 42 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 2-氯-6-苯并噻唑基，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 42 之化合物 1 中的 Ar 是 2-氯-6-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 42 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 42 之化合物中的 Ar 是 2-氯-6-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 42 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 43

表 43 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 2-溴-6-苯并噻唑基，n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 43 之化合物 1 中的 Ar 是 2-溴-6-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 43 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣

地，除了表 43 之化合物中的 Ar 是 2-溴-6-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 43 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 44

表 44 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 2-甲胺基-6-苯并噻唑基， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 44 之化合物 1 中的 Ar 是 2-甲胺基-6-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 44 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 44 之化合物中的 Ar 是 2-甲胺基-6-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 44 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 45

表 45 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 1-甲基-5-吡啶基， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 45 之化合物 1 中的 Ar 是 1-甲基-5-吡啶基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 45 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 45 之化合物中的 Ar 是 1-甲基-5-吡啶基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 45 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 46

表 46 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 2-甲基-5-吡啶基， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為

甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 46 之化合物 1 中的 Ar 是 2-甲基-5-吡啶基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 46 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 46 之化合物中的 Ar 是 2-甲基-5-吡啶基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 46 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 47

表 47 係由 90 個通式(1)之化合物所組成，其中 Ar 是 2-甲基-5-苯并噻唑基， n 是 0， R^1 是甲基， R^2 是氫， R^3 和 R^4 二者為甲基且 R^5 具有表 14 中所列之值。因此，除了表 47 之化合物 1 中的 Ar 是 2-甲基-5-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 47 之化合物 1 係與表 34 之化合物 1 相同。同樣地，除了表 47 之化合物中的 Ar 是 2-甲基-5-苯并噻唑基而不是 6-苯并噻唑基之外，表 47 之化合物 2 至 90 係分別與表 34 之化合物 2 至 90 相同。

表 48 至 94

表 48 至 94 恰對應於表 1 至 47 (亦即表 48 恰對應於表 1，表 49 恰對應於表 2，以此類推)，唯一的差別在於表 48 至 94 之各表中， n 是 1 而不是 0。

表 95 至 141

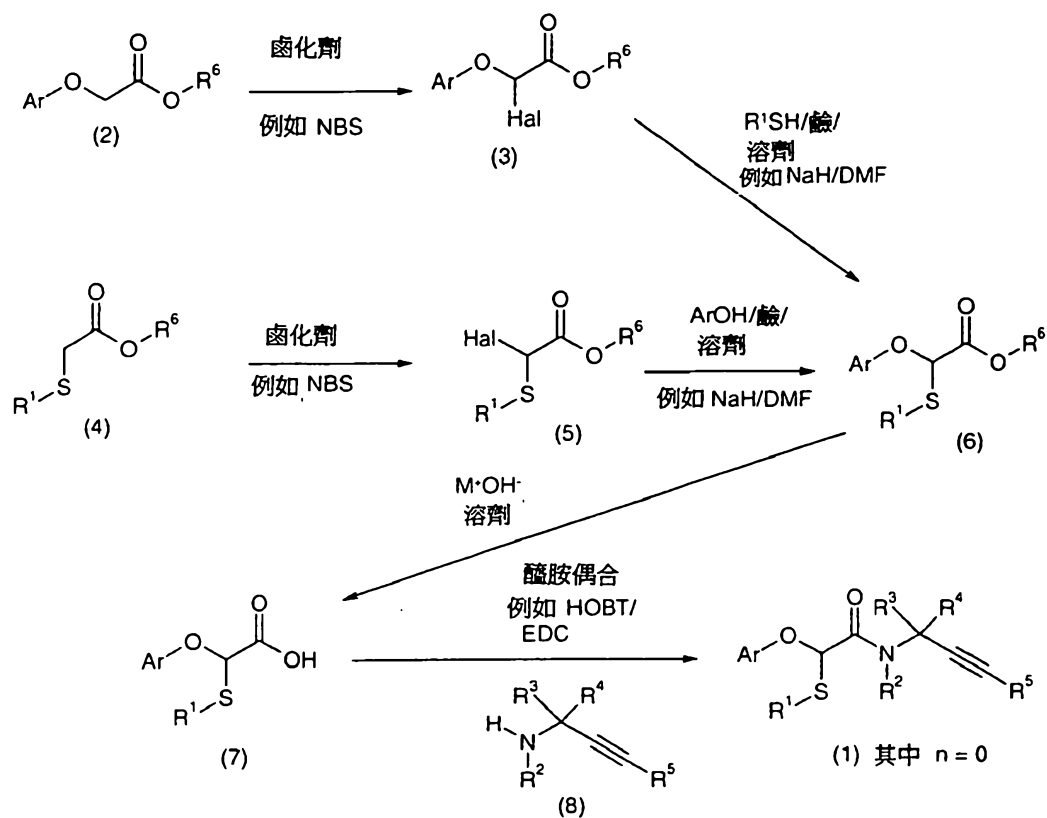
表 95 至 141 恰對應於表 1 至 47 (亦即表 95 恰對應於表 1，表 96 恰對應於表 2，以此類推)，唯一的差別在於表 95 至 141 之各表中， n 是 2 而不是 0。

實施方式

通式(1)之化合物可如下方案 1 至 4 所概述者製備，其中 Ar、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^5 具有以上所給之意義， R^6 是 H 或 C_{1-4} 烷基，如所示者， R^a 是 H 或 C_{1-3} 烷基， R^b 是 H 或 C_{1-3} 烷基，但前提是，當 R^a 和 R^b 二者為烷基時，它們的碳原子總數不超過 3 個， R^c 是 C_{1-6} 烷基、視需要經取代之苄基或視需要經取代之噻吩甲基，DMF 是 N,N-二甲基甲醯胺，NBS 是 N-溴琥珀醯亞胺，NCS 是 N-氯琥珀醯亞胺，以及 MCPBA 是間氯過苯甲酸。其他縮寫係定義於文中。

式(1)化合物，其中 n 是 0 者，可如方案 1 中所示者製備。式(2)之酯（其中 R^6 是 C_{1-4} 烷基）可經由與鹵化劑如 N-溴琥珀醯亞胺反應被鹵化而得到式(3)之鹵代酯（其中 Hal 是鹵素原子，如溴、氯或碘），此反應係在適當溶劑如四氯化碳或乙腈中，於自由基起始劑如 AIBN（偶氮異丁腈）與光源的存在下，在周圍溫度與溶劑回流溫度之間進行。然後使通式(3)之化合物與通式 R^1SH 之烷硫醇於鹼如氫化鈉存在下在適當溶劑如 DMF 中反應，而得到通式(6)之化合物，或者與烷硫醇鹽 $R^1S^-M^+$ （其中 M 是金屬，如鈉或鋰）在適當溶劑如 DMF 中反應，而得到通式(6)之化合物。

方案 1

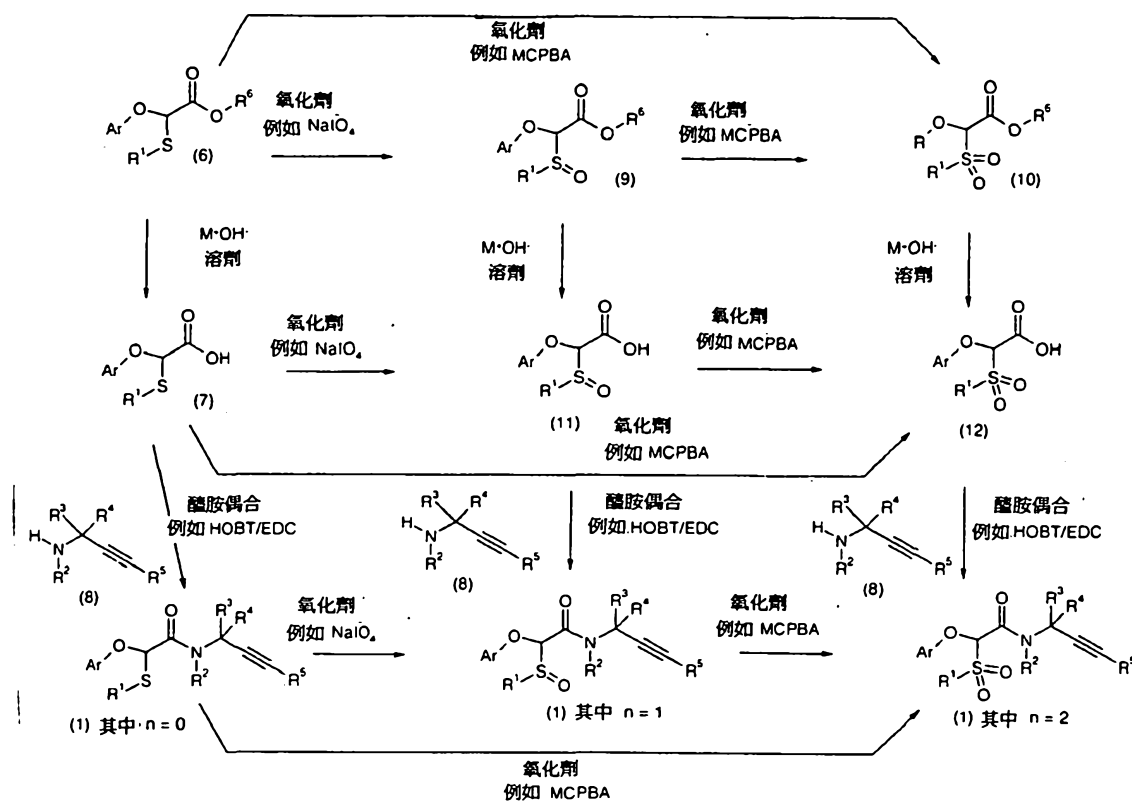


或者，通式(4)之酯係經由與鹵化劑如 N-氯琥珀醯亞胺或 N-溴琥珀醯亞胺反應被鹵化而得到式(5)之鹵代酯(式中 Hal 是鹵素原子，如溴、氯或碘)，此反應係在適當溶劑如四氯化碳或乙腈中，在 0°C 與溶劑回流溫度之間進行。通式(5)之酯係與羥基(雜)芳基 ArOH (其中 Ar 係如以上所定義) 於鹼如第三丁醇鉀、碳酸鉀或氫化鈉存在下，在適當溶劑如第三丁醇、1,4-二噁烷或 DMF 中，在周圍溫度與溶劑回流溫度之間反應，而得到式(6)之化合物。式(6)之化合物係經由與鹼金屬氫氧化物 M^+OH^- 反應而被水解成式(7)之酸，此反應係在適當溶劑如甲醇、乙醇或 THF (四氫呋喃) 水溶液中，於周圍溫度與溶劑回流溫度之間進行。式(7)之酸可與式(8)之胺縮合，此係使用適當活化劑

如 HOBT (1-羥基苯并三唑) 和 EDC (鹽酸 1-乙基-3-N,N-二甲氨基丙基碳二亞胺) 於 0°C 與周圍溫度之間進行，而得到其中 n 是 0 之通式(1)化合物。

通式(1)化合物，其中 n 是 1 或 2 者，係如方案 2 中所示者，經由氧化成亞砜 (n 是 1) 或砜 (n 是 2) 氧化態而製備。舉例來說，可於 0°C 與溶劑回流溫度之間，在適當溶劑如乙醇中，用氧化劑如過碘酸鈉將通式(6)之酯氧化成通式(9)之亞砜。通式(10)之砜可於 0°C 與溶劑回流溫度之間，在適當溶劑如二氯甲烷中，用二或更多當量之氧化劑如間氯過苯甲酸 (MCPBA) 而直接從式(6)化合物製得；或可用一或更多當量之間氯過苯甲酸而從式(9)之亞砜製得。式(6)之亞砜、式(9)之亞砜或式(10)之砜可經由與鹼金屬氫氧化物在適當溶劑如乙醇中於 0°C 與溶劑回流溫度之間反應，接著酸化，而被水解成對應的酸(7)、(11)或(12)。式(7)、(11)或(12)之酸可與式(8)之胺縮合，此係使用適當活化劑如 HOBT 和 EDC 於 0°C 與周圍溫度之間進行，而得到其中 n 是 0、1 或 2 之通式(1)化合物。

方案 2:

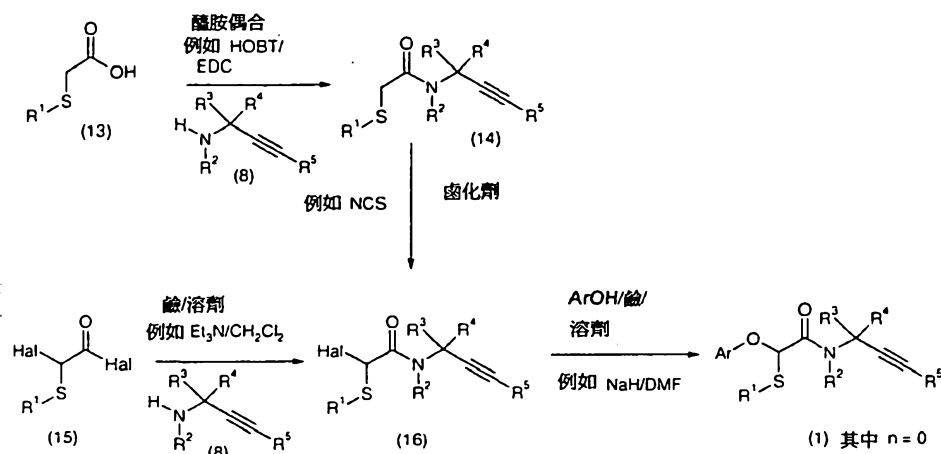


類似地，其中 n 是 1 之式 (11) 與式 (1) 之亞砷可藉由使用氧化劑如偏過碘酸鈉或間氯過苯甲酸，而分別從其中 n 是 0 之式 (7) 與式 (1) 之硫化物製備，如上所述者。其中 n 是 2 之式 (12) 與式 (1) 之砷可藉由使用至少二當量之氧化劑如間氯過苯甲酸從其中 n 是 0 之式 (7) 與式 (1) 之硫化物製備，或可藉由使用一或更多當量之氧化劑如間氯過苯甲酸而從其中 n 是 1 之式 (11) 與式 (1) 之亞砷製備。

式 (1) 化合物亦可如方案 3 中所示者製備。式 (13) 之酸可與式 (8) 之胺縮合，此係使用適當活化劑如 HOBt 和 EDC 於 0°C 與周圍溫度之間進行，而得到式 (14) 化合物。式 (14) 化合物可經由使用鹵化劑如 N-氯琥珀醯亞胺被鹵化而得到式 (16) 化合物，此係在適當溶劑如四氯化碳或乙腈中

，在 0°C 與周圍溫度之間進行。式(16)之醯胺亦可製自式(15)之醯基氯，此係經由與式(8)之胺於鹼如三乙胺存在下在適當溶劑如二氯甲烷，在 0°C 與周圍溫度之間的反應。

方案 3

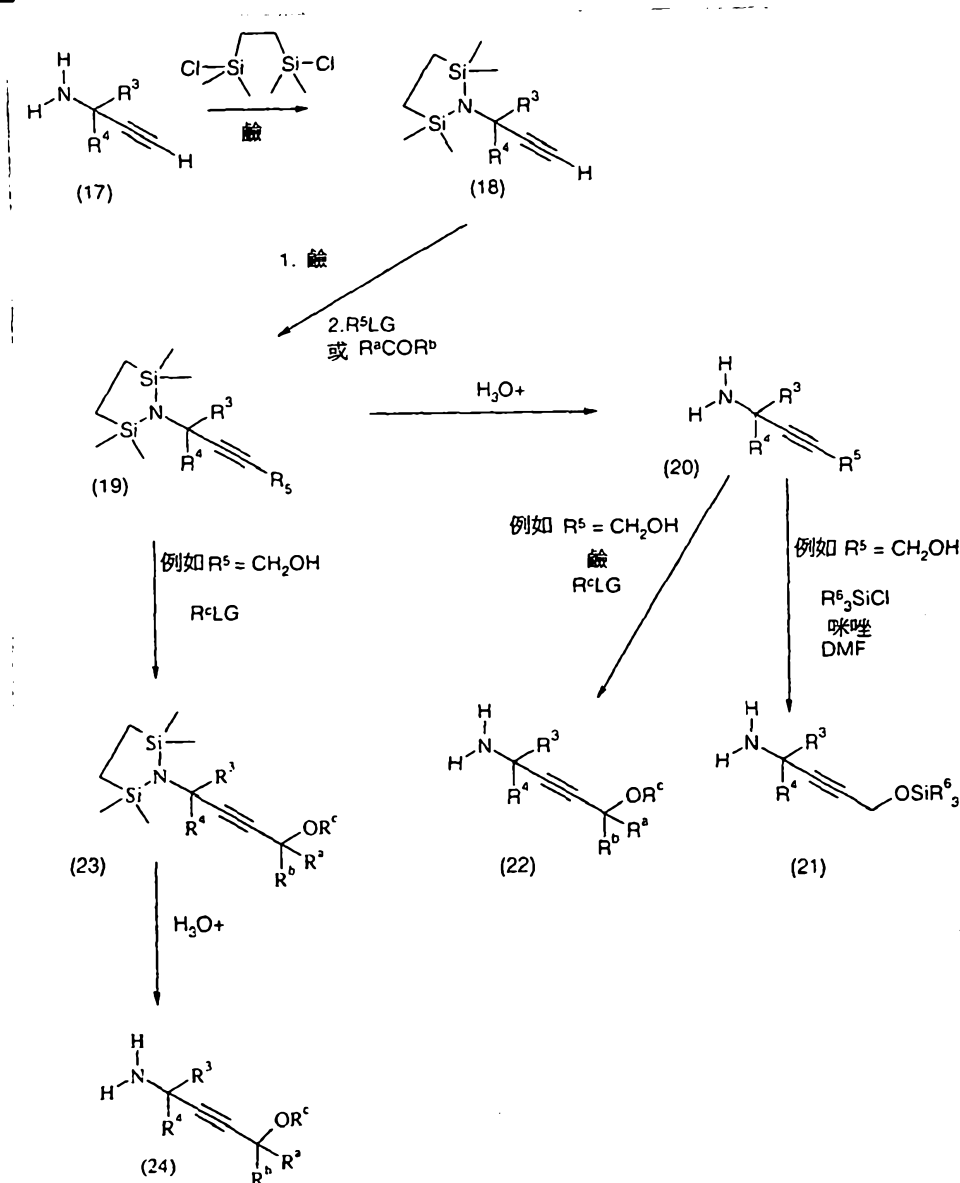


式 16 之鹵代硫醚可與羥基(雜芳基)ArOH 反應，此係於鹼如碳酸鉀或氫化鈉存在下，在適當溶劑如 DMF 中，於 0°C 與 80°C 之間進行，而得到其中 n 是 0 的式(1)化合物。

如方案 4 中所示，通式(20)之胺類，其為其中 R^2 是 H 之通式(8)胺類的例子，可藉由通式(18)之經甲矽烷基保護之胺基炔的烷基化製備：使用適當鹼如正丁基鋰，接著與適當烷基化試劑 R^5LG 如烷基碘(例如甲基碘)反應，以形成通式(19)之烷基化化合物。以類似程序，通式(18)之經甲矽烷基保護之胺基炔可使用適當鹼如正丁基鋰而與羰基衍生物 R^aCOR^b (如甲醛)反應，而提供含有羥烷基部分的胺基炔(19)。然後可用例如酸水溶液將該甲矽烷基保護基從通式(19)之化合物除去，而形成通式(20)之胺基炔。通式(20)之胺基炔可進一步衍生，舉例來說，當 R^5 是羥烷基時，則例如藉由使通式(20)之化合物與甲矽烷基化劑如第

三丁基二甲基甲矽烷基氯反應，而得到通式(21)之於氧上被甲矽烷基化的衍生物。除此之外，通式(20)之化合物可與鹼如氫化鈉或雙(三甲基甲矽烷基)醯胺化鉀反應，接著與化合物 R^cLG 反應，而得到通式(22)之化合物。在一替代順序中，通式(19)之化合物可與鹼如雙(三甲基甲矽烷基)醯胺化鈉或鉀反應，接著與化合物 R^cLG 反應，其中 LG 代表離去基，如鹵素，或磺酸酯，如 OSO_2Me ，或 OSO_2-4- 甲基苯基，例如乙基碘，而在除去甲矽烷基保護基之後得到通式(22)之化合物。

方案 4



通式(18)之甲矽烷基保護之胺基炔可經由使通式(17)之胺與 1,2-雙-(氣二甲基甲矽烷基)乙烷在適當鹼(如三級有機胺鹼,例如三乙胺)的存在下反應而獲得。

通式(17)之胺可為市面上可獲得者或可藉由標準文獻方法製備(例如參見 EP-A-0834498)。

通式(1)之化合物為有效殺真菌劑且可用來控制下列病原菌之一或多者:米和小麥上的稻熱病菌(*Pyricularia oryzae*) (稻瘟病菌(*Magnaporthe grisea*))及在其他宿主上的其他梨胞霉屬(*Pyricularia*)亞種;小麥上的小麥鏽菌(*Puccinia triticina*) (或隱匿條鏽菌(*Puccinia recondite*))、條形柄鏽菌(*Puccinia striiformis*)及其他鏽菌,大麥上的大麥柄鏽菌(*Puccinia hordei*)、條形柄鏽菌及其他鏽菌,以及其他宿主(例如草皮、黑麥、咖啡、梨、蘋果、花生、甜菜、蔬菜和觀賞植物)上的鏽菌;瓜類(例如瓜)上的二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*);大麥、小麥、黑麥和草皮上的麥類白粉菌(*Blumeria* 或 *Erysiphe graminis*) (白粉病菌)及在各種不同宿主上的其他白粉病菌,例如在啤酒花上的草莓白粉病菌(*Sphaerotheca macularis*)、在瓜類(例如黃瓜)上的瓜類白粉病菌(*Sphaerotheca fusca*) (黃瓜白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*))、在蕃茄、茄子和青椒上的甜椒白粉病菌(*Leveillula taurica*)、在蘋果上的蘋果白粉病菌(*Podosphaera Leucotricha*)及在蔓生植物上的葡萄白粉病菌(*Uncinula necator*);在穀類植

物（例如小麥、大麥、黑麥）、草皮及其他宿主上的旋孢腔菌屬（*Cochliobolus*）亞種、長蠕孢屬（*Helminthosporium*）亞種、內臍蠕孢屬（*Drechslera*）亞種（核腔菌屬（*Pyrenophora*）亞種）、喙孢屬（*Rhynchosporium*）亞種、禾生球腔菌（*Mycosphaerella graminicola*）（小麥殼針孢（*Septoria tritici*））及小麥囊子菌（*Phaeosphaeria nodorum*）（小麥殼多孢（*Stagonospora nodorum*）或小麥穎枯病菌（*Septoria nodorum*））、小麥假小尾孢（*Pseudocercospora herpotrichoides*）和小麥全蝕病菌（*Gaeumannomyces graminis*）；在花生上的落花生尾孢（*Cercospora arachidicola*）和落花生短胖孢（*Cercosporidium personatum*）及在其他宿主如甜菜、香蕉、大豆和米上的其他尾孢屬（*Cercospora*）亞種；在蕃茄、草莓、蔬菜、蔓生植物和其他宿主上的灰葡萄孢（*Botrytis cinerea*）（灰霉菌）及在其他宿主上的其他葡萄孢屬亞種；在蔬菜（例如胡蘿蔔）、油菜子、蘋果、蕃茄、馬鈴薯、穀類植物（例如小麥）及其他宿主上的鏈格孢屬（*Alternaria*）亞種；在蘋果、梨、核果、樹果及其他宿主上的黑星菌屬（*Venturia*）亞種（包括蘋果黑星菌（*Venturia inaequalis*）（瘡痂病））；在一範圍宿主，包括穀類植物（例如小麥）和蕃茄上的枝孢屬（*Cladosporium*）亞種；在核果、樹果和其他宿主上的鏈核盤菌屬（*Monilinia*）亞種；在蕃茄、草皮、小麥、瓜類及其他宿主上的亞隔孢

殼屬 (*Didymella*) 亞種；在油菜子、草皮、米、馬鈴薯、小麥及其他宿主上的莖點霉屬 (*Phoma*) 亞種；在小麥、木材和其他宿主上的曲霉屬 (*Aspergillus*) 亞種和短梗霉屬 (*Aureobasidium*) 亞種；在豌豆、小麥、大麥及其他宿主上的殼二孢屬 (*Ascochyta*) 亞種；在蘋果、梨、洋蔥及其他宿主上的葡柄霉屬 (*Stemphylium*) 亞種 (格孢腔菌屬 (*Pleospora*) 亞種)；在蘋果和梨上的夏季疾病 (例如苦腐病 (椽果炭疽病菌 (*Glomerella cingulata*))、黑腐病或蛙眼葉斑病 (鈍葡萄座腔菌 (*Botryosphaeria obtusa*))、黑點病 (蘋果黑點病菌 (*Mycosphaerella pomi*))、Cedar 蘋果鏽病 (梨鏽菌 (*Gymnosporangium juniperi-virginiae*))、煤霉病 (仁果黏殼孢 (*Gloeodes pomigena*))、昆蟲排泄物 (短裂盾菌 (*Schizothyrium pomi*)) 及白腐病 (葡萄座腔菌 (*Botryosphaeria dothidea*)))；在蔓生植物上的葡萄生單軸霉 (*Plasmopara viticola*)；其他露菌病菌，例如在萵苣上的萵苣盤枝霉 (*Bremia lactucae*)、在大豆、煙草、洋蔥和其他宿主上的霜霉屬 (*Peronospora*) 亞種、在啤酒花上的葎草假霜霉 (*Pseudoperonospora humuli*) 及在瓜類上的古巴假霜霉 (*Pseudoperonospora cubensis*)；在草皮和其他宿主上的腐霉屬 (*Pythium*) 亞種 (包括終極腐霉 (*Pythium ultimum*))；在馬鈴薯和蕃茄上的致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 及在蔬菜、草莓、鱈梨、胡椒、觀賞植物、煙草、可可樹及其他宿主上的其他疫霉屬 (

Phytophthora) 亞種；在米和草皮上的瓜亡革菌 (*Thanatephorus cucumeris*) 及在各種不同宿主如小麥和大麥、花生、蔬菜、棉和草皮上的其他絲核菌屬 (*Rhizoctonia*) 亞種；在草皮、花生、馬鈴薯、油菜子及其他宿主上的核盤菌屬 (*Sclerotinia*) 亞種；在草皮、花生和其他宿主上的小核菌屬 (*Sclerotium*) 亞種；在米上的藤倉赤霉 (*Gibberella fujikuroi*)；在一範圍宿主，包括草皮、咖啡和蔬菜上的炭疽菌屬 (*Colletotrichum*) 亞種；在草皮上的紅線病菌 (*Laetisaria fuciformis*)；在香蕉、花生、柑橘、胡桃、木瓜及其他宿主上的球腔菌屬 (*Mycosphaerella*) 亞種；在柑橘、大豆、瓜、梨、羽扇豆及其他宿主上的間座殼屬 (*Diaporthe*) 亞種；在一範圍宿主，包括啤酒花、馬鈴薯和蕃茄上的輪枝孢屬 (*Verticillium*) 亞種；在油菜子和其他宿主上的埋核盤菌屬 (*Pyrenopeziza*) 亞種；在可可樹上引起脈管條紋梢枯病的可可樹梢枯病菌 (*Oncobasidium theobromae*)；在各種不同宿主，特別是小麥、大麥、草皮和玉蜀黍上的鏈孢霉屬 (*Fusarium*) 亞種、核瑚菌屬 (*Typhula*) 亞種、雪腐微座菌 (*Microdochium nivale*)、黑粉菌屬 (*Ustilago*) 亞種、條黑粉菌屬 (*Urocystis*) 亞種、腥黑粉菌屬 (*Tilletia*) 亞種及麥角菌 (*Claviceps purpurea*)；在甜菜、大麥和其他宿主上的柱隔孢屬 (*Ramularia*) 亞種；特別是水果的採收後疾病 (例如在柳橙上的指狀青霉 (*Penicillium digitatum*)、義大利青霉 (*Penicillium*

italicum) 和綠色木霉 (*Trichoderma viride*)，在香蕉上的香蕉炭疽病菌 (*Colletotrichum musae*) 和香蕉盤長孢 (*Gloeosporium musarum*) 及在葡萄上的灰葡萄孢；在蔓生植物上的其他病原菌，值得注意的是葡萄頂枯病菌 (*Eutypa lata*)、葡萄球座菌 (*Guignardia bidwellii*)、火木層孔菌 (*Phellinus igniarius*)、葡萄枝枯病菌 (*Phomopsis viticola*)、維管束假盤菌 (*Pseudopeziza tracheiphila*) 及毛韌革菌 (*Stereum hirsutum*)；在樹上 (例如葉震病菌 (*Lophodermium seeditiosum*)) 或木材上的其他病原菌，值得注意的是 *Cephaloascus fragrans*、長喙殼屬 (*Ceratocystis*) 亞種、雲杉病菌 (*Ophiostoma piceae*)、青霉屬 (*Penicillium*) 亞種、假康寧木霉 (*Trichoderma pseudokoningii*)、綠色木霉、木素木霉 (*Trichoderma harzianum*)、黑曲霉 (*Aspergillus niger*)、*Leptographium lindbergi* 及出芽短梗霉 (*Aureobasidium pullulans*)；以及病毒疾病的真菌傳染媒介 (例如在穀類植物上的麥類多黏霉 (*Polymyxa graminis*) 為大麥黃化嵌紋病毒 (BYMV) 的傳染媒介，以及在甜菜上的甜菜多黏霉 (*Polymyxa betae*) 為甜菜叢根病的傳染媒介)。

通式(1)化合物特別顯示出對抗卵菌綱 (*Oomycete*) 病原菌如致病疫霉、單軸霉 (例如葡萄生單軸霉) 和腐霉 (例如終極腐霉) 的良好活性。

通式(1)化合物可在植物組織中向頂、向基或局部地移

動，以有效對抗一或多種真菌。此外，通式(1)化合物可具有足夠揮發性，以便在氣相中有效對抗植物上的一或多種真菌。

本發明因此提供一種對抗或控制植物病原真菌之方法，其包括將殺真菌有效量之式(1)化合物或含式(1)化合物之組成物施用於植物、植物種子、植物或種子的所在地或土壤或任何其他植物生長媒質如養料溶液上。

“植物”一詞當用於本文時，係包括幼苗、灌木和樹木。另外，本發明之殺真菌方法包括保護性、治癒性、系統性、根除及抗孢子的處理。

為了農藝、園藝及牧地方面的目的，式(1)化合物最好是以組成物形式使用。

為了將式(1)化合物施用於植物、植物種子、植物或種子的所在地或土壤或任何其他植物生長媒質上，通常係將式(1)化合物調配成組成物，其除了式(1)化合物之外，還包含適當的惰性稀釋劑或載劑，以及視需要選用的表面活性劑(SFA)。SFA是能夠藉由降低表面張力改變界面(例如液/固、液/氣或液/液等界面)性質，並藉此導致其他性質(例如分散、乳化和潤濕)變化的化學物質。較佳的是，所有組成物(固體和液體調配物二者)包含0.0001至95重量%，更佳1至85重量%，例如5至60重量%的式(1)化合物。組成物一般來說係用以控制真菌，如此則式(1)化合物係以每公頃0.1克至10公斤，較佳每公頃1克至6公斤，更佳為每公頃1克至1公斤的比例來施用。

當用於拌種 (seed dressing) 時，式(1)化合物係以每公斤種子 0.0001 克至 10 克 (例如 0.001 克或 0.05 克)，較佳 0.005 克至 10 克，更佳為 0.005 克至 4 克的比例使用。

另一方面，本發明提供一種包含殺真菌上有效量之式(1)化合物及其適當載劑或稀釋劑的殺真菌組成物。

更進一步方面，本發明提供一種在一場所對抗與控制真菌之方法，其包括用殺真菌上有效量之含式(1)化合物之組成物處理真菌或真菌所在地。

組成物可選自於數種調配物類型，包括粉劑 (DP)、可溶性粉劑 (SP)、水溶性粒劑 (SG)、水分散性粒劑 (WG)、可濕性粉劑 (WP)、粒劑 (GR) (緩釋或速效)、可溶性濃縮劑 (SL)、油混溶性液劑 (OL)、超低量液劑 (UL)、可乳化濃縮劑 (EC)、可分散濃縮劑 (DC)、乳劑 (水包油 (EW) 和油包水 (EO) 二者)、微乳劑 (ME)、懸浮濃縮劑 (SC)、氣溶膠、煙/霧調配物、膠囊懸浮劑 (CS) 及種子處理調配物。在任何情況下所選擇的調配物類型將取決於所設想的特殊目的及式(1)化合物之物理、化學和生物學性質。

粉劑 (DP) 可製備如下：將式(1)化合物與一或多種固體稀釋劑 (例如天然黏土、高嶺土、葉蠟石、膨潤土、礬土、蒙脫土、矽藻土、白堊、矽藻土 (diatomaceous earths)、磷酸鈣、碳酸鈣和鎂、硫、石灰、麵粉、滑石及其他有機和無機固體載劑) 混合，然後用機械將該混合

物研磨成細微粉末。

可溶性粉劑 (SP) 可製備如下：將式(1)化合物與一或多種水溶性無機鹽類 (例如碳酸氫鈉、碳酸鈉或硫酸鎂) 或一或多種水溶性有機固體 (例如多醣) 及視需要選用以改良水分散性/溶解性之一或多種潤濕劑、一或多種分散劑或該等藥劑之混合物混合。然後將混合物研磨成細微粉末。類似的組成物亦可經造粒而形成水溶性粒劑 (SG)。

可濕性粉劑 (WP) 可製備如下：將式(1)化合物與一或多種固體稀釋劑或載劑、一或多種潤濕劑和最好是一或多種分散劑及視需要選用以幫助在液體中分散作用之一或多種懸浮劑混合。然後將混合物研磨成細微粉末。類似的組成物亦可經造粒而形成水分散性粒劑 (WG)。

粒劑 (GR) 可形成如下：將式(1)化合物與一或多種粉狀固體稀釋劑或載劑的混合物造粒，或者藉由將式(1)化合物 (或其在適當藥劑中的溶液) 吸收至多孔粒狀物質 (如浮石、厄帖浦石黏土、漂白土、矽藻土或碎玉米穗軸) 中，或將式(1)化合物 (或其在適當藥劑中的溶液) 吸附至硬核物質 (例如砂、矽酸鹽、無機碳酸鹽、硫酸鹽或磷酸鹽) 及必要時乾燥之，而從預先形成的空白顆粒得到。常用來幫助吸收或吸附的藥劑包括溶劑 (例如脂族和芳族石油溶劑、醇類、醚類、酮類和酯類) 和黏著劑 (例如聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖和蔬菜油)。一或多種其他添加劑亦可被包含在粒劑中 (例如乳化劑、濕潤劑或分散劑)。

可分散濃縮劑 (DC) 可經由將式(1)化合物溶於水或有機溶劑如酮、醇或乙二醇醚中而製備。這些溶劑可含有表面活性劑 (比如說, 以改良水稀釋性或預防在噴霧槽中結晶)。

可乳化濃縮劑 (EC) 或水包油乳劑 (EW) 可經由將式(1)化合物溶於有機溶劑 (視需要含有一或多種濕潤劑、一或多種乳化劑或該等藥劑的混合物) 中而製備。適合用於 EC 的有機溶劑包括芳族烴 (例如烷基苯或烷基萘, 以 SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 和 SOLVESSO 200 為例; SOLVESSO 是註冊商標)、酮類 (例如環己酮或甲基環己酮)、醇類 (例如苯甲醇、糠醇或丁醇)、N-烷基吡咯烷酮 (例如 N-甲基吡咯烷酮或 N-辛基吡咯烷酮)、脂肪酸的二甲基甲醯胺 (例如 C₈-C₁₀ 脂肪酸二甲基甲醯胺) 及氯代烴。EC 產物可在加到水中時自發地乳化而產生具有足夠安定性的乳劑, 以容許經由適當設備的噴霧施用。EW 的製備包括獲得液體 (若在周圍溫度下不為液體, 則可在合理的溫度範圍, 通常在 70°C 下將它熔化) 或於溶液中 (將它溶於適當溶劑中) 的式(1)化合物, 然後在高剪力下, 將所液體或溶液乳化至含有一或多種 SFA 的水中, 以產生乳劑。適合用於 EW 的溶劑包括蔬菜油、氯代烴 (例如氯苯)、芳族溶劑 (例如烷基苯或烷基萘) 及其他具有低水溶性的適當有機溶劑。

微乳劑 (ME) 可製備如下: 將水和一或多種溶劑與一或多種 SFA 之摻合物混合, 以自發地產生熱力學上安定的

各向同性液體調配物。式(1)化合物最初係存在於水或該溶劑/SFA 摻合物中。適合用於 ME 的溶劑包括前文所敘述適合用於 EC 或 EW 者。ME 可為水包油或油包水系統（存在何系統可由傳導性測量來決定）且可適合在相同調配物中混合水溶性和油溶性殺蟲劑。ME 適合稀釋至水中，無論是維持微乳劑或形成習知的水包油乳劑。

懸浮濃縮劑（SC）可包含式(1)化合物細碎不溶性固體粒子的水性或非水性懸浮劑。SC 可製備如下：在適當媒質中，將式(1)化合物視需要與一或多種分散劑一起球磨或珠磨，以產生該化合物之細粒懸浮劑。一或多種濕潤劑可被包含在該組成物中且懸浮劑可被包含在內以降低粒子沈降的速率。或者，可將式(1)化合物乾磨後再加入到含有前述藥劑的水中，以產生所要的終產物。

氣溶膠調配物包含式(1)化合物和適當推進劑（例如正丁烷）。式(1)化合物亦可被溶解或分散於適當媒質（例如水或水混溶性液體如正丙醇）中，以提供用於非加壓、手動噴霧泵中的組成物。

式(1)化合物可於乾燥狀態與煙火混合物混合，以形成適合用以在密閉空間產生含該化合物煙霧的組成物。

膠囊懸浮劑（CS）可以類似於製備 EW 調配物的方式製備，但加上額外的聚合階段，而獲得油滴的水性懸浮劑，其中各油滴係被聚合殼包封起來且含有式(1)化合物及其視需要選用的載劑或稀釋劑。該聚合殼可經由界面縮合聚合反應或凝聚程序製得。這些組成物可供式(1)化合物之控制

釋出用且它們可用於種子處理。式(1)化合物亦可被調配於可生物降解之聚合基質中，以提供該化合物的緩慢控制釋出。

組成物可包含一或多種添加劑來改良該組成物的生物學效能（例如經由改良表面上的濕潤、滯留或分佈；在經處理表面上的抗雨性；或式(1)化合物的攝入或遷移率）。這類添加劑包括：表面活性劑，以油，例如某些礦物油或天然植物油（例如大豆和菜子油）為主之噴霧添加劑，以及這些與其他生物促進佐劑（可輔助或修飾式(1)化合物作用的成分）的摻合物。

式(1)化合物亦可調配成用來作為種子處理劑，例如作為粉劑組成物，包括乾燥種子處理（DS）的粉劑、水溶性粉劑（SS）或淤漿處理用水分散性粉劑（WS），或作為液體組成物，包括流動濃縮劑（FS）、溶液（LS）或膠囊懸浮劑（CS）。DS、SS、WS、FS 和 LS 組成物的製備分別非常類似於上述 DP、SP、WP、SC 和 DC 組成物的製備。處理種子的組成物可包含用來協助組成物對種子黏著性的藥劑（例如礦物油或成膜隔離層）。

濕潤劑、分散劑和乳化劑可為陽離子、陰離子、兩性離子或非離子型的 SFA。

適當陽離子型的 SFA 包括四級銨化合物（例如溴化鯨蠟基三甲基銨）、咪唑啉及胺鹽。

適當陰離子 SFA 包括：脂肪酸的鹼金屬鹽，硫酸脂族單酯的鹽（例如月桂基硫酸鈉），磺化芳族化合物的鹽（

例如十二烷基苯磺酸鈉、十二烷基苯磺酸鈣、丁基萘磺酸及二異丙基萘磺酸鈉和三異丙基萘磺酸鈉的混合物)，醚硫酸鹽、醇醚硫酸鹽（例如月桂基聚氧乙烯醚（laureth）-3-硫酸鈉），醚羧酸鹽（例如月桂基聚氧乙烯醚-3-羧酸鈉），磷酸酯（得自一或多種脂肪醇與磷酸（主要是單酯）或五氧化磷（主要是二酯）之間反應，例如月桂醇與四磷酸之間反應的產物；此外，這些產物可被乙氧基化），磺基琥珀酸鹽，石蠟烴或烯烴磺酸鹽、牛磺酸鹽和木素磺酸鹽。

適當兩性離子型 SFA 包括甜菜鹼、丙酸鹽和胺基乙酸鹽。

適當非離子型 SFA 包括氧化烯，例如氧化乙烯、氧化丙烯、氧化丁基或其混合物，與脂肪醇（例如油醇或鯨蠟醇）或與烷基酚（例如辛基酚、壬基酚或辛基甲酚）的縮合產物；衍生自長鏈脂肪酸或己糖醇酐的部分酯；該部分酯與氧化乙烯的縮合產物；嵌段共聚物（包含氧化乙烯和氧化丙烯）；烷醇醯胺；簡單酯（例如脂肪酸聚乙二醇酯）；胺氧化物（例如氧化月桂基二甲基胺）；及卵磷脂。

適當懸浮劑包括親水性膠體（例如多醣、聚乙烯吡咯烷酮或羧甲基纖維素鈉）及溶脹性黏土（例如膨潤土或厄帖浦石）。

式(1)化合物可藉由已知施用殺真菌化合物工具的任一者來施用。舉例來說，其可被（經調配或未經調配）施用於植物任意部分，包括葉、莖、枝或根，在種植之前施用

於種子或施用於植物生長或擬種植的媒質（例如根周圍的土壤、通常是土壤、稻田水或水耕系統），以直接方式，或者可將其噴霧、撒佈、浸漬施用、以膏狀或糊狀調配物施用、以蒸氣施用或經由將組成物（例如粒狀組成物或包裝於水溶性袋子內的組成物）分佈或摻混於土壤或水性環境來施用。

式(1)組成物亦可被注入植物或利用電動力噴霧技術或其他低量方法噴灑至植物上，或者藉由田地或空氣灌溉系統施用。

用作水性製劑（水溶液或水分散液）的組成物通常係以含高比例活性成分的濃縮劑形式來供應，該濃縮劑係在使用之前加到水中。這些濃縮劑可包括 DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG 和 CS，通常需要能耐受貯存長時間，而且在這樣的貯存之後能夠加到水中形成水性試劑，其維持均勻一段充足時間以使它們得藉由習知噴霧設備施用。這類水性製劑可含有各種不同量的式(1)化合物（例如 0.0001 至 10 重量%），此係視其所欲使用的目的而定。

式(1)化合物可以與肥料（例如含氮、鉀或磷的肥料）的混合物使用。適當的調配物類型包括肥料的粒劑。這些混合物宜含有高達 25 重量%的式(1)化合物。

本發明因此亦提供一種包含肥料和式(1)化合物的肥料組成物。

本發明的組成物可含有其他具有生物活性的化合物，例如微養料或具有類似或互補殺真菌活性的化合物或具有

植物生長調節、除草、殺蟲、殺線蟲或殺蟎活性者。

藉由包含其他殺真菌劑，所得組成物可具有比式(1)化合物單獨來說更廣譜的活性或更大的固有活性水平。此外，其他殺真菌劑可具有對式(1)化合物之殺真菌活性的協同效果。

式(1)化合物可為組成物的唯一活性成分，或者恰當時它可與一或多種額外的活性成分如殺蟲劑、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑摻混。額外的活性成分可以：提供具有較廣譜活性或於一所在地增加持久性的組成物；增加式(1)化合物的活性或補充活性（例如經由增加作用速度或克服排斥）；或者有助於克服或預防對單獨成分的抗性發展。此特別額外的活性成分將取決於該組成物的意欲用途。

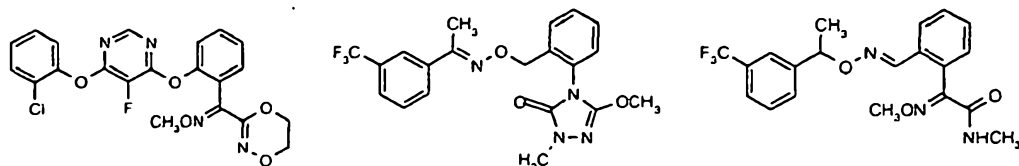
可被包含在本發明組成物內的殺真菌組成物的例子有：AC 382042 (N-(1-氟基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)丙醯胺)，苯并二噻唑硫代羧酸甲酯 (acibenzolar-S-methyl)，棉鈴威 (alanycarb)，烷二甲嗎啡 (aldimorph)，敵菌靈 (anilazine)，阿扎康唑 (azaconazole)，草芬定 (azafenidin)，亞托敏 (azoxystrobin)，本達樂 (benalaxyl)，免賴得 (benomyl)，苯噻顯胺甲酸 (benthiavalicarb)，雙苯三唑醇 (biloxyzol)，雙苯三唑醇 (bitertanol)，滅瘟素 (blasticidin S)，波斯卡利 (boscalid) (尼聯苯 (nicobifen) 的新名稱)，溴克座 (bromuconazole)，布

瑞莫 (bupirimate) , 四氣丹 (captan) , 蓋普丹 (captan) , 貝芬替 (carbendazim) , 鹽酸貝芬替 (carbendazim chlorhydrate) , 萎鏽靈 (carboxin) , 加普胺 (carpropamid) , 香芹酮 (carvone) , CGA 41396 , CGA 41397 , 甲基克殺蟎 (chinomethionate) , 氯苯噻脲 (chlorbenzthiazone) , 四氣異苯 (chlorothalonil) , 克氣得 (chlorozolinate) , 克己空 (clozylacon) , 含銅化合物 , 例如氧氯化銅、羥喹啉酸銅、硫酸銅、樹脂酸銅和波爾多液 (Bordeaux mixture) , 氰胺偶氮磺醯胺 (cyamidazosulfamid) , 賽座滅 (cyazofamid) (IKF-916) , 賽扶芬胺 (cyflufenamid) , 克絕 (cymoxanil) , 環克座 (cyproconazole) , 賽普洛 (cyprodinil) , 咪菌威 (debacarb) , 1,1'-二氧二-2-吡啶基二硫醚 , 益發靈 (dichlofluanid) , 大克賽滅 (diclocymet) , 達滅淨 (diclomezine) , 大克爛 (dicloran) , 乙霉威 (diethofencarb) , 待克利 (difenoconazole) , 野燕枯 (difenzoquat) , 二氟林 (diflumetorim) , 硫代磷酸 0,0-二異丙基-S-苄酯 , 二甲氟唑 (dimefluazole) , 二甲克座 (dimetconazole) , 二甲噻吩 (dimethirimol) , 達滅芬 (dimethomorph) , 二甲氧菌酯 (dimoxystrobin) , 達克利 (diniconazole) , 白粉克 (dinocap) , 腈硫醯 (dithianon) , 氯化十二烷基二甲基銨 , 敵草隆 (dodemorph) , 多寧 (dodine) , 多瓜定 (doguadine) , 護粒松 (edifenphos) , 依普座 (epoxiconazole) , 依殺

胺 (ethaboxam) , 依瑞莫 (ethirimol) , (Z)-N-苄基-N([甲基(甲基-硫代亞乙基胺氧基羰基)胺基]硫基)-β-丙胺酸乙酯 , 依得利 (etridiazole) , 凡殺同 (famoxadone) , 芬胺酮 (fenamidone) , 芬瑞莫 (fenarimol) , 芬克座 (fenbuconazole) , 甲呋醯胺 (fenfuram) , 環醯菌胺 (fenhexamid) , 禾草靈 (fenoxanil) (AC 382042) , 拌種咯 (fenciclonil) , 苯鏽啉 (fenpropidin) , 芬普福 (fenpropimorph) , 三苯醋錫 (fentin acetate) , 三苯羥錫 (fentin hydroxide) , 富爾邦 (ferbam) , 富米綜 (ferimzone) , 扶吉胺 (fluazinam) , 護汰寧 (fludioxonil) , 福路滅 (flumetover) , 氟嗎 (flumorph) , 氟亞胺 (fluoroimide) , 氟惡菌酯 (fluoxastrobin) , 氟喹唑 (fluquinconazole) , 護矽得 (flusilazole) , 氟硫滅 (flusulfamide) , 福多寧 (flutolanil) , 護汰芬 (flutriafol) , 福爾培 (folpet) , 福賽得 (fosetyl-aluminium) , 麥穗寧 (fuberidazole) , 呋霜靈 (furalaxyl) , 福拉比 (furametpyr) , 克熱淨 (guazatine) , 菲克利 (hexaconazole) , 羥基異噁唑 , 殺紋寧 (hymexazole) , 依滅列 (imazalil) , 易胺座 (imibenconazole) , 克熱淨 (iminocadine) , 克熱淨乙酸鹽 (iminocadine triacetate) , (ipconazole) , 依普克座 (iprobenfos) , 依普同 (iprodone) , 顯霉威 (iprovalicarb) , 胺基甲酸異丙基丁酯 , 亞賜圃 (isoprothiolane) , 嘉賜黴素 (kasugamycin) , 克收欣 (

kresoxim-methyl) , LY 186054 , LY 211795 , LY 248908 ,
鋅錳乃浦 (mancozeb) , 錳乃浦 (maneb) , 滅芬殺 (mfenoxame) , 滅派林 (mepanipyrim) , 滅普寧 (mepronil) , 滅達樂 (metalaxyl) , 右滅達樂 (metalaxyl M) , 葉菌唑 (metconazole) , 免得爛 (metiram) , 鋅免得爛 (metiram-zinc) , 苯氧菌胺 (metominostrobin) , 滅芬同 (metrafenone) , MON 65500 (N-烯丙基-4,5-二甲基-2-三甲基甲矽烷基噻吩-3-醯胺) , 邁克尼 (myclobutanil) , NTN0301 , 田安 (neoasozin) , 二甲基二硫代胺基甲酸鎳 , 硝基異酞酸異丙酯 (nitrothale-isopropyl) , 尼瑞莫 (nuarimol) , 呋醯胺 (ofurace) , 有機汞化合物 , 歐立沙菌胺 (orysastrobin) , 毆殺斯 (oxadixyl) , 環氧嘧磺隆 (oxasulfuron) , 歐索林酸 (oxolinic acid) , 歐普克座 (oxpoconazole) , 嘉保信 (oxycarboxin) , 披扶座 (pefurazoate) , 平克座 (penconazole) , 賓克隆 (pencycuron) , 殺枯淨 (phenazin oxide) , 磷酸 , 熱必斯 (phthalide) , 啞氧菌酯 (picoxystrobin) , 保粒黴素(丁) (polyoxin D) , 保利農 (polyram) , 撲殺熱 (probenazole) , 撲克拉 (prochloraz) , 撲滅寧 (procymidone) , 普拔克 (propamocarb) , 普拔克 (propamocarb hydrochloride) , 普克利 (propiconazole) , 甲基鋅乃浦 (propineb) , 丙酸 , 丙喹利 (proquinazid) , 丙硫克座 (prothioconazole) , 百克敏 (pyraclostrobin) , 白粉松

(pyrazophos)，比芬諾 (pyrifenox)，派美尼 (pyrimethanil)，百快隆 (pyroquilon)，吡氧呔 (pyroxyfur)，吡咯菌素 (pyrrolnitrin)，四級銨化合物，滅蟊猛 (quinomethionate)，快諾芬 (quinoxifen)，五氯硝基苯 (quintozene)，甲矽賽芬胺 (silthiofam) (MON 65500)，S-依滅列，矽氟克座 (simeconazole)，西普克座 (sipconazole)，五氯酚鈉，螺草胺 (spiroxamine)，鏈黴素，硫黃，得克利 (tebuconazole)，四氯硝基苯 (tecnazene)，四克利 (tetraconazole)，腐絕 (thiabendazole)，賽氟滅 (thifluzamide)，2-(硫氰基甲硫基)苯并噻唑，甲基多保淨 (thiophanate-methyl)，得恩地 (thiram)，太地尼 (tiadinil)，替本克座 (timibenconazole)，脫克松 (tolclofos-methyl)，甲基益發靈 (tolyfluanid)，三泰芬 (triadimefon)，三泰隆 (triadimenol)，丁基三唑 (triazbutil)，咪唑吡 (triazoxide)，三賽唑 (tricyclazole)，三得芬 (tridemorph)，三氟敏 (trifloxystrobin)，賽福座 (triflumizole)，賽福寧 (triforine)，滅菌唑 (triticonazole)，維利黴素 A (validamycin A)，斯美地 (vapam)，免克寧 (vinclozolin)，XRD-563，鋅乃浦 (zineb)，福美鋅 (ziram)，左殺安 (zoxamide) 及下列各式之化合物：



式(1)化合物可與土壤、泥煤或其他可供保護植物對抗種子傳播、土壤傳播或葉面真菌疾病之生根媒質混合。

一些混合物可包含具有顯著不同物理、化學或生物學性質的活性成分，如此它們便不容易地適合相同的習知調配物類型。在這些情況下，可製備其他調配物類型。舉例來說，當一活性成分是不溶於水的固體而另一種是不溶於水的液體時，則有可能藉由將固體活性成分分散成懸浮劑（使用類似 SC 的製備方法）但將液體活性成分分散成乳劑（使用類似 EW 的製備方法）而將各活性成分分散在同一連續水相中。所得組成物則為水懸乳劑（SE）調配物。

本發明係藉由下列實施例說明，其中使用到下列縮寫

:

ml=毫升

g=克

THF=四氫呋喃

M⁺=質量離子

s=單峰

d=雙重峰

bs=寬單峰

t=三重峰

q=四重峰

m=多重峰

m.p.=熔點（未校正）

b.p.=沸點

DMSO=二甲亞砜

DMF=N,N-二甲基甲醯胺

HOBt=1-羥基苯并三唑

EDC=鹽酸 1-乙基-3-N,N-二甲基胺基

丙基碳二亞胺

NMR=核磁共振

HPLC=高效液相層析

TLC 薄層層析

glc=氣-液相層析

ppm=每百萬份之份數

dec.=分解

M=莫耳濃度

實施例 1

本實施例係說明 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 1 之化合物編號 4) 之製備

步驟 1

將 2-溴-2-(3,5-二氯苯氧基)乙酸第三丁酯 (1.0g) 溶於 1,4-二噁烷 (3ml)，然後將硫代甲醇鈉 (0.218g) 加到此混合物中。將所得淺黃色懸浮劑在周圍溫度下攪拌 5 小時，然後保存 18 小時。將溶劑蒸發，加水，並用乙酸乙酯 (100ml) 萃取水層二次。將有機層合併，用食鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥，過濾及蒸發，得到 2-甲硫基-2-(3,5-二氯苯氧基)乙酸第三丁酯，為淺黃色固體 (0.80g)，其未經進一步純化即用於下一步驟中。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.52 (9H, s); 2.19 (3H, s); 5.39 (1H, s); 6.92 (2H, d); 7.04 (1H, t).

步驟 2

在溶於周圍溫度甲醇 (3ml) 之步驟 1 產物 (0.2g) 中加入氫氧化鈉 (0.050g) 於水 (1ml) 中的溶液。將反應攪拌 2 小時，將溶劑蒸發，然後添加水和乙酸乙酯。將水相分離，用稀鹽酸水溶液酸化，然後用乙酸乙酯萃取。將有機相合併，經硫酸鎂乾燥過濾及蒸發，得到 2-甲硫基-2-(3,5-二氯苯氧基)乙酸，為淺黃色膠 (0.153g)，其未經

進一步純化即用於下一步驟中。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.21 (3H, s); 5.59 (1H, s); 6.95 (2H, s); 7.08 (1H, s).

步驟 3

將三乙胺 (0.1ml) 加到 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽 (0.077g) 於 DMF (2ml) 之已攪拌溶液中，得到白色懸浮劑。將得自步驟 2 之產物 (0.153g) 加入 DMF (1ml) 中，接著加入 1-羥基苯并三唑 (HOBT, 0.078g)，最後加入鹽酸 N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳二亞胺 (EDC, 0.110g)。將白色懸浮劑於周圍溫度下攪拌 1 小時，然後保存 18 小時。加水，並用乙酸乙酯萃取水相。將有機相合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥，過濾及蒸發，得到黃色固體 (0.148g)，其係經由於矽凝膠上使用 1:4 體積比之乙酸乙酯/己烷洗提之急驟管柱層析純化，得到標題化合物，為無色固體 (0.145g)，m. p. 120-122°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (6H, s); 1.83 (3H, s); 2.16 (3H, s); 5.42 (1H, s); 6.58 (1H, bs); 6.94 (2H, d); 7.09 (1H, t).

4-胺基-4-甲基戊-2-炔係製備如下：

步驟 1

將 3-胺基-3-甲基丁炔 (市面上可以 90% 水溶液購得; 16.6g) 溶於二氯甲烷 (150ml) 中，經硫酸鈉乾燥及過濾，得到含 14.9g 胺的溶液。在已經於周圍溫度氮氣氛下攪拌過的胺溶液中加入無水三乙胺 (48.4ml)。然後逐滴

加入 1,2-雙-(氯二甲基甲矽烷基)乙烷 (38.98) 於二氯甲烷 (100ml) 中之溶液，藉由冷卻使反應溫度維持在 15°C。將混合物攪拌 3 小時，將反應期間形成的無色固體從溶液中過濾出來並蒸發濾液，得到糊狀物。將該糊狀物萃取至己烷中並再過濾。將濾液蒸發，並將所獲得的油蒸餾，得到 1-(1,1-二甲基-2-丙炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷，(21.5g)，於 0.06 mm Hg 壓力下之 b. p. 41°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 0.16 (12H, s); 0.60 (4H, s); 1.48 (6H, s); 2.24 (1H, s).

步驟 2

將得自步驟 1 之產物 (13.0g) 於無水 THF (140ml) 之溶液於氮氣氛下伴隨攪拌冷卻至 -70°C，然後在 5 分鐘期間於 -65 至 -70°C 下添加正丁基鋰的溶液 (23.1ml 的 2.5M 己烷溶液)。使混合物溫熱到 -5°C，於 10 分鐘期間逐滴加入甲基碘 (3.93ml)。使反應混合物溫熱到 10°C，此時發生放熱反應。藉由冷卻使混合物維持在 20°C，然後蒸發至小量體積。將殘餘物溶於己烷中，過濾除去不溶物質及蒸發，得到 1-(1,1-二甲基-2-丁炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷，為黃色油 (13.0g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 0.10 (12H, s); 0.56 (4H, s); 1.40 (6H, s); 1.72 (3H, s).

步驟 3

將得自步驟 2 之產物 (13.0g) 伴隨攪拌慢慢地加到

0°C 的鹽酸水溶液 (35ml, 4M) 中。將所形成之乳劑攪拌 0.5 小時，然後用氫氧化鈉水溶液 (4M) 調至 pH 14，同時藉由在冰塊中冷卻將反應混合物維持在 0°C。將此水性混合物萃取至二氯甲烷中 (三次)，然後將萃取液合併，經硫酸鈉乾燥及過濾。藉由添加過量的鹽酸於 1,4-二噁烷中之飽和溶液使濾液變酸性。在減壓下濃縮此混合物，直到形成無色沈澱物為止。將己烷加到此懸浮劑中，並將固體從溶液中過濾出來。將固體用無水二乙醚洗滌並置於真空下除去任何殘餘的溶劑，得到 4-氨基-4-甲基戊-2-炔，為無色固體 (5.0g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.74 (6H, s); 1.82 (3H, s); 8.74 (3H, 寬信號)。

以類似實施例 1 步驟 3 之程序，使 1,2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與鹽酸 1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基胺縮合，得到 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺 (表 34 之化合物編號 90)，為黃色油。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (6H, s); 1.92-2.00 (2H, m); 2.20 (3H, s); 2.40 (2H, t); 3.66 (2H, t); 5.54 (1H, s); 6.72 (1H, s); 7.22-7.26 (1H, dd); 7.58 (1H, d); 8.09 (1H, d); 8.92 (1H, s)。

以類似實施例 1 步驟 3 之程序，使 1,2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基乙酸與鹽酸 1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基胺縮合，得到 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氯-6-

甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺(表 31 之化合物 149), 為無色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.04 (3H, t); 1.62 (6H, s); 1.92-2.04 (4H, m); 2.38-2.42 (2H, t); 3.68 (2H, t); 4.46 (1H, t); 6.30 (1H, s); 7.26 (1H, m); 8.28 (2H, m).

實施例 2

本實施例係說明 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-(甲炔亞磺醯基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺(表 48 之化合物編號 4) 之製備

在 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺(0.080g) 於 0°C 二氯甲烷(3ml) 之溶液中逐滴加入間氯過苯甲酸(0.077g, 70% 純度)。將所得白色懸浮劑在周圍溫度下攪拌 4-5 小時, 然後保存 18 小時。將該懸浮劑溶於更多的二氯甲烷中, 用飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌, 乾燥及蒸發, 得到無色油(0.20g)。此係經由於矽凝膠(40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯/己烷(1:1 至 2:1 體積) 洗提之急驟管柱層析純化, 得到標題化合物(0.064g), 為非對映異構體的 1:1 混合物。 ^1H NMR 數據係就非對映異構體的混合物表示。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.62, 1.64, 1.65 (4x3H, 3s); 1.80 和 1.81 (2x3H, 2s); 2.67 和 2.77 (2x3H, 2s); 5.18 和 5.40 (2H, 2s); 6.64 和 6.82 (2H, 2bs); 6.98 和 7.06 (2x2H, 2s); 7.10 和 7.12 (2H, 2s).

實施例 3

本實施例係說明 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 95 之化合物編號 4) 之製備

在 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (0.042g) 於 0°C 二氯甲烷 (2ml) 之溶液中逐滴加入間氯過苯甲酸 (0.125g, 70% 純度)。將所得白色懸浮劑在周圍溫度下攪拌 4-5 小時，然後保存 18 小時。將該懸浮劑溶於更多的二氯甲烷中，用飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到無色油 (0.070g)。此係經由矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯/己烷 (1:2 體積比) 洗提之急驟管柱層析純化，得到標題化合物，為無色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.66 (3H, s); 1.67 (3H, s); 1.82 (3H, s); 3.14 (3H, s); 5.27 (1H, s); 6.73 (1H, bs); 7.04 (2H, d); 7.15 (1H, t).

實施例 4

本實施例係說明 2-(甲硫基)-2-(喹啉基-6-氧基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 14 之化合物編號 2) 之製備

步驟 1

將 N-溴琥珀醯亞胺 (NBS, 4.37g) 和偶氮-異丁腈 (AIBN, 催化量) 加到 2-甲硫基乙酸乙酯 (3.0g) 於四氯化碳 (20ml) 之溶液中，並於周圍溫度下攪拌 2 小時。加入另外的 NBS (0.30g)，並將反應攪拌另 3 小時。將反應混

合物過濾及蒸發濾液，得到 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯 (6.5g)，此係未經進一步純化即使用。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.30 (3H, s); 2.34 (3H, s); 4.26 (2H, q); 5.39 (1H, s).

步驟 2

將第三丁醇鉀溶於第三丁醇 (8ml) 中，並於周圍溫度下將混合物攪拌 20 分鐘。添加 6-羥基喹啉 (1.5g)，並在此深綠色溶液中加入得自步驟 1 之產物 (2.0g)。將反應攪拌 20 分鐘，保存 18 小時，然後攪拌 5 小時。將混合物倒入水中，用氯仿萃取，並將有機相用食鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥，過濾，然後蒸發，得到深棕色油 (1.75g)。此油係經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯/己烷 (1:2 體積比) 洗提之急驟管柱層析純化，得到 2-甲硫基-2-喹啉-6-氧基乙酸乙酯，為橙色油 (0.66g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.35 (3H, t); 2.25 (3H, s); 4.34 (2H, m); 5.73 (1H, s); 7.25 (1H, d); 7.39 (1H, dd); 7.51 (1H, dd); 8.05 (1H, m); 8.08 (1H, m); 8.82 (1H, dd).

步驟 3

以類似實施例 1 步驟 2 之程序，將 2-甲硫基-2-喹啉-6-氧基乙酸乙酯水解，得到 2-甲硫基-2-喹啉基-6-氧基乙酸。

步驟 4

以類似實施例 1 步驟 3 之程序，將得自步驟 3 之酸與

4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽縮合，得到標題化合物。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.69 (3H, s); 1.70 (3H, s); 1.82 (3H, s); 2.22 (3H, s); 5.64 (1H, s); 6.76 (1H, s); 7.28 (1H, d); 7.40 (1H, dd); 7.47 (1H, dd); 8.09 (1H, m); 8.84 (1H, dd).

實施例 5

本實施例係說明 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 31 之化合物編號 3) 之製備

步驟 1

將 5-氯-3-羥基吡啶 (1.30g)、2-溴 2 甲硫基乙酸乙酯 (2.43g, 70% 純度) 和無水碳酸鉀 (1.38g) 在無水 DMF (15ml) 中攪拌，並伴隨攪拌加熱到 80°C 維持 1 小時。將混合物冷卻到周圍溫度，倒入水中，然後用二乙醚萃取 (三次)。將萃取液合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到油，其係經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用己烷/乙酸乙酯 (1:1 體積比) 洗提之急驟管柱層析純化，得到 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)乙酸乙酯，為橙色油 (0.65g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.34-1.38 (3H, t); 2.20 (3H, s); 4.30-4.38 (2H, m); 5.58 (1H, s); 7.38 (1H, m); 8.30-8.32 (2H, d).

步驟 2

將溶於 THF (10ml) 之步驟 1 產物 (0.62g) 與含有氫

氧化鈉 (0.19g) 的水 (3ml) 於 60°C 攪拌 1.5 小時，然後冷卻到周圍溫度並保存 18 小時。將混合物蒸發，並將殘餘物用水稀釋，然後用二乙醚洗滌。將水性部分用稀鹽酸酸化並用乙酸乙酯萃取。將萃取液合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)乙酸，0.48g，為深黃色膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.24 (3H, s); 5.72 (1H, s); 7.54 (1H, m); 8.34 (1H, s); 8.40 (1H, s); 9.52 (1H, bs).

步驟 3

將三乙胺 (0.40ml) 加到 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽 (0.25g) 於 DMF (10ml) 之攪拌過的溶液中，得到白色懸浮劑。添加 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)乙酸 (0.46g) 於無水 DMF (10ml) 中之溶液，接著添加 HOBT (0.28g) 和 EDC (0.40g)。將此白色懸浮劑在周圍溫度下攪拌 3 小時，然後保存 18 小時。將萃取液合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到黃色膠。此膠係經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯/己烷 (2:1 體積比) 洗提之急驟管柱層析純化，得到標題化合物，為黃色膠 (0.33g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.84 (3H, s); 2.18 (3H, s); 5.48 (1H, s); 6.62 (1H, bs); 7.38 (1H, m); 8.30-8.32 (2H, m).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(3-溴-喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基-1-甲氧基戊-2-炔

鹽酸鹽縮合，得到 2-(3-溴-喹啉基-6-氧基)-2-(甲硫基)-N-(5-甲氧基-2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 20 之化合物編號 12)，為淡黃色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.73 (6H, s); 2.21 (3H, s); 3.38 (3H, s); 4.12 (2H, s); 5.62 (1H, s); 6.72 (1H, s); 7.18 (1H, d); 7.74 (1H, dd); 8.06 (1H, d); 8.25 (1H, d); 8.82 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基-1-甲氧基戊-2-炔鹽酸鹽縮合，得到 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基-N-(5-甲氧基-2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 31 之化合物編號 25)，為油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.73 (6H, s); 2.17 (3H, s); 3.38 (3H, s); 4.12 (2H, s); 5.50 (1H, s); 6.63 (1H, bs); 7.38 (1H, t); 8.31 (1H, d); 8.33 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基乙酸與 3-胺基-3-甲基丁炔鹽酸鹽縮合，得到 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基丁-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 31 之化合物編號 2)，為淡棕色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.72 (6H, s); 2.18 (3H, s); 2.40 (1H, s); 5.52 (1H, s); 6.64 (1H, s); 7.38 (1H, m); 8.32 (2H, m).

實施例 6

本實施例係說明 2-(5-溴吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)-

N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 31 之化合物編號 91) 之製備

步驟 1

將 3,5-二溴吡啶 (30.0g) 加到甲醇鈉 (製自 11.6g 鈉) 於甲醇 (120ml) 之攪拌過的溶液中，並在氮氣氛下加熱到回流維持 70 小時。將混合物冷卻到周圍溫度，倒入水中，用二乙醚萃取，然後將萃取液合併，用水洗滌並經硫酸鎂乾燥。將溶劑蒸發得到 3-溴-5-甲氧基吡啶，為無色液體，其在保存時慢慢地結晶 (19.3g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 3.86 (3H, s); 7.35-7.37 (1H, m); 8.24-8.30 (2H, m).

步驟 2

將步驟 1 之產物 (11.58g) 與氫溴酸水溶液 (60ml; 48% w/v) 混合，並伴隨攪拌加熱到 120°C 維持 48 小時，將混合物冷卻到周圍溫度，倒入水中並用氫氧化鈉水溶液 (2M) 使其成鹼性。將水相用二乙醚萃取並將有機萃取液倒棄。用濃鹽酸使水相成 pH 6-7，並將已經形成的沈澱物從溶液中過濾出來。將固體用水洗滌並在真空下抽氣至乾燥，得到 5-溴-3-吡啶醇，為無色固體，(8.67g)，m. p. 151-154°C。

^1H NMR (d_6 -DMSO) δ ppm: 7.52-7.54 (1H, m); 8.22-8.30 (2H, m); 10.50-10.80 (1H, bs).

步驟 3

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，將 5-溴-3-吡啶醇與

2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(5-溴吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)乙酸乙酯，為橙色油。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.32-1.36 (3H, t); 2.20 (3H, s); 4.30-4.38 (2H, m); 5.58 (1H, s); 7.52 (1H, m); 8.34 (1H, s); 8.40 (1H, s).

步驟 4

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(5-溴吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)乙酸乙酯水解，得到 2-(5-溴吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)乙酸，為黃色固體，m. p. 126-128°C (dec)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.24 (3H, s); 5.72 (1H, s); 7.68 (1H, m); 8.42 (2H, bs); 9.28 (1H, bs).

步驟 5

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(5-溴吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到標題化合物，為黃色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (6H, s); 1.84 (3H, s); 2.18 (3H, s); 5.48 (1H, s); 6.62 (1H, bs); 7.52 (1H, m); 8.34 (1H, d); 8.42 (1H, m).

實施例 7

本實施例係說明 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 78 之化合物編號 3) 之製備

將溶於含水 (4ml) 之乙醇 (4ml) 中的 2-(5-氯吡啶

基-3-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (0.10g) 用過碘酸鈉 (0.075g) 處理，並在周圍溫度下攪拌。將混合物攪拌 2 小時，保存 18 小時，攪拌另 8 小時，然後添加另外的過碘酸鈉 (0.045g)，將反應攪拌 4 小時，然後保存 18 小時。添加另外的過碘酸鈉 (0.005g) 並將混合物攪拌 4 小時，然後倒入水中，用乙酸乙酯萃取，用食鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥及蒸發，得到標題化合物，為一種膠 (0.070g)。NMR 光譜係與含非對映異構體 1:1 混合物的物質一致。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.66 (6H, s); 1.82 (3H, s); 2.70(s)和 2.82(s)總共 3H; 5.22(s)和 5.46(s)總共 1H; 6.68(s)和 6.88(s)總共 1H; 7.44(m)和 7.5(m)總共 1H; 8.36-8.42 (2H, m).

實施例 8

本實施例係說明 2-(5-溴吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 125 之化合物編號 91) 之製備

將溶於二氯甲烷 (5ml) 之 2-(5-溴吡啶基-3-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (0.114g) 在周圍溫度下攪拌，並添加過乙酸 (0.1ml, 36% wt/於乙酸中之體積)。將混合物攪拌 1.25 小時，添加另外的過乙酸 (0.05ml, 36% wt/於乙酸中之體積) 並將反應攪拌另 1 小時。將混合物蒸發，殘餘的膠係經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯/己烷 (2:1 體積比) 洗提之急驟管柱

層析純化，得到標題化合物，為黏稠的無色膠（0.08g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.67 (3H, s); 1.68 (3H, s); 1.84 (3H, s); 3.18 (3H, s); 5.32 (1H, s); 6.82 (1H, s); 7.66 (1H, m); 8.44 (1H, s); 8.46 (1H, s).

實施例 9

本實施例係說明 N-氧化 2-(5-氯-3-吡啶氧基)-2-(甲磺基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 125 之化合物編號 139) 之製備

將溶於二氯甲烷 (5ml) 之 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-(甲磺基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (0.11g) 伴隨攪拌冷卻到 0°C ，並將 3-氯過苯甲酸 (0.85g, 60% 過酸) 分幾部分加入。完全添加之後，將混合物攪拌 0.5 小時，在周圍溫度下攪拌 1 小時，然後保存 18 小時。將混合物蒸發並將殘餘物溶解於乙酸乙酯中。將溶液用碳酸氫鈉水溶液、食鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到黃色膠。此膠係經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯洗提之急驟管柱層析純化，得到標題化合物，為黏稠膠 (0.030g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (6H, s); 1.82 (3H, s); 3.18 (3H, s); 5.50 (1H, s); 7.18 (1H, s); 7.24 (1H, s); 8.06 (1H, s); 8.24 (1H, s).

實施例 10

本實施例係說明 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-(甲磺基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 34 之化合物編號 2

) 之製備

步驟 1

將 2-氨基-6-甲氧基苯并噻唑 (9.0g) 於無水 DMF (10ml) 之溶液於 35 分鐘期間逐滴添加亞硝酸第三丁酯 (9.9ml) 於 65°C DMF (40ml) 之攪拌過的溶液中。在添加期間將混合物溫度維持在 <73°C。完成苯并噻唑溶液的添加之後，將深紅色溶液攪拌額外的 15 分鐘，冷卻到室溫，然後倒入稀鹽酸 (200ml) 中並用食鹽水稀釋。將深紅色懸浮劑用二乙醚萃取，將固體過濾，然後用另外的水和二乙醚洗滌。將二乙醚萃取液合併，水溶液部分則用乙酸乙酯再萃取。將有機部分合併，用水洗滌並經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到棕色固體。此固體係經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用己烷/乙酸乙酯 (4:1 體積比) 洗提之急驟管柱層析純化，得到 6-甲氧基苯并噻唑，為無色固體 (2.1g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 3.89 (3H, s); 7.12 (1H, dd); 7.40 (1H, d); 8.01 (1H, d); 8.82 (1H, s).

步驟 2

將步驟 1 之產物 (1.2g) 於氫溴酸 (10ml; 48%) 中之溶液於 120°C 伴隨攪拌加熱 6 小時，然後保存在周圍溫度下 2 天。此熱的淡黃色溶液在冷卻時產生懸浮劑。藉由添加水將懸浮劑溶解，然後藉由添加碳酸氫鈉將溶液調整到 pH 6，將所沈澱的固體從溶液中過濾出來，用水洗滌並抽氣到乾燥。將固體溶解於乙酸乙酯中，使溶液經硫酸鎂

乾燥及蒸發，得到 6-羥基苯并噻唑，為無色固體（1.05g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 7.07 (1H, dd); 7.91 (1H, d); 8.76 (1H, d); 9.18 (1H, s).

步驟 3

將步驟 2 之產物（1.10g）、2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯（2.22g，73%純度）和無水碳酸鉀（2.0g）在 80°C 的無水 DMF（5ml）中攪拌 0.5 小時，然後冷卻到周圍溫度。將混合物倒入飽和氯化銨水溶液中，用稀鹽酸使之成酸性，然後用二乙醚萃取。將萃取易用水洗滌，經硫酸鎂乾燥及蒸發，得到棕色膠。此膠係經由矽凝膠（40-60 篩目）上使用己烷/乙酸乙酯（1:1 體積比）洗提之急驟管柱層析純化，得到 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-(甲硫基)乙酸乙酯，為黃色固體（0.50g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.37 (3H, t); 2.27 (3H, s); 4.30-4.42 (2H, m); 5.65 (1H, s); 7.28 (1H, m); 7.59 (1H, m); 8.08 (1H, d); 8.90 (1H, s).

步驟 4

將步驟 3 之產物（0.50g）於 THF（4ml）之攪拌過的溶液中加入單水合氫氧化鋰（0.076g）於周圍溫度水（1ml）中的溶液。1 小時之後，用稀硫酸使混合物成酸性，用二乙醚萃取，並將萃取液經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-(甲硫基)乙酸，為淡黃色固體（0.45g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.28 (3H, s); 5.72 (1H, s); 7.28 (1H, dd); 7.60 (1H, m); 8.11 (1H, d); 8.99 (1H, s).

步驟 5

伴隨攪拌用三乙胺 (0.525ml) 處理 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽 (0.252g) 於無水 DMF (7ml) 之溶液。將 1-羥基苯并三唑 (0.27g) 加到懸浮劑中，接著添加鹽酸 1-(3-二甲胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺 (0.363g)，接著添加步驟 4 產物 (0.45g) 於無水 DMF (3ml) 中之溶液。將反應在周圍溫度下攪拌 2 小時，保存 18 小時，添加食鹽水，然後用二乙醚萃取混合物。將萃取液合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到一種膠。此膠係經由層析 (二氧化矽；己烷/乙酸乙酯，1:1 體積比) 分級，得到標題化合物，為淡黃色膠 (0.42g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.78 (3H, s); 1.80 (3H, s); 1.82 (3H, s); 2.20 (3H, s); 5.54 (1H, s); 6.77 (1H, bs); 7.23 (1H, dd); 7.58 (1H, m); 8.09 (1H, d); 8.92 (1H, s).

實施例 11

本實施例係說明 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 81 之化合物編號 2) 之製備

在 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (0.12g) 於乙醇 (5ml) 之溶液中加入過碘酸鈉 (0.154g) 於周圍溫度水 (5ml) 中之溶液。將混合物攪拌 2 小時，保存 18 小時，添加食鹽水並用乙酸乙酯萃

取混合物。將萃取液用食鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到標題化合物，為無色膠（0.090g）。NMR 光譜係與含非對映異構體 1:1 混合物的物質一致。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.67 (3H, s); 1.69 (3H, s); 1.80(s)和 1.82(s)總共 3H; 2.72(s)和 2.83(s)總共 3H; 5.28(s)和 5.53(s)總共 1H; 6.81(s)和 6.94(s)總共 1H; 7.29(dd)和 7.33(dd)總共 1H; 7.67(m)和 7.79(m)總共 1H; 8.09(m)和 8.94(m)總共 1H.

實施例 12

本實施例係說明 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-(甲硫基)-N-(5-甲氧基-2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 34 之化合物編號 12) 之製備

步驟 1

在 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸 (0.248g) 於無水二氯甲烷 (5ml) 之攪拌過的溶液中加入草醯氯 (0.085ml)。將混合物在周圍溫度下攪拌 1 小時，然後蒸發，得到 2-(苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙醯氯，為棕色膠，其未經進一步純化即用於下一步驟。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.22 (3H, s); 5.82 (1H, s); 7.31 (1H, dd); 7.59 (1H, d); 8.20 (1H, d); 9.20 (1H, s).

步驟 2

在步驟 1 產物 (0.123g) 於周圍溫度無水二氯甲烷 (5ml) 之攪拌過的溶液中加入 4-胺基-4-甲基-1-甲氧基戊-2-炔鹽酸鹽 (0.078g)，接著添加無水三乙胺 (0.13ml)

。將棕色溶液於周圍溫度下攪拌 18 小時，用二氯甲烷稀釋並用水洗滌。將有機相經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到棕色膠。此膠係經由層析（二氧化矽；己烷/乙酸乙酯，1：1 體積比）分級，得到標題化合物，為淡棕色膠（0.113g）。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.72 (3H, s); 1.73 (3H, s); 2.20 (3H, s); 3.39 (3H, s); 4.12 (2H, s); 5.56 (1H, s); 6.67 (1H, s); 7.22 (1H, dd); 7.58 (1H, m); 8.09 (1H, d); 8.92 (1H, s).

4-胺基-4-甲基-1-甲氧基戊-2-炔鹽酸鹽係製備如下。

步驟 1

將 1-(1,1-二甲基-2-丙炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷 (22.6g) 於無水 THF (250ml) 之溶液於氮氣氛下伴隨攪拌冷卻至 -50°C ，然後在 10 分鐘期間添加正丁基鋰的溶液 (44ml, 2.5M 己烷溶液)。將混合物攪拌 0.5 小時，使其溫熱到 -20°C ，然後將甲醛氣成泡吹過混合物，直到沒有起始物留下，如 glc 分析所測定者。完成反應後，將混合物用水處理，將醚相分離，並用乙酸乙酯萃取水相 (二次)。將有機萃取物合併，用水洗滌 (三次)，經硫酸鎂乾燥及蒸發，得到 1-(1,1-二甲基-4-羥基-2-丁炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷，為淡黃色液體 (24.96g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 0.00 (12H, s); 0.46 (4H, s); 1.32 (6H, s); 4.10 (2H, s).

步驟 2

將得自步驟 1 之產物 (24.96g) 用稀鹽酸水溶液 (300ml) 處理，並於周圍溫度下攪拌 0.5 小時。將混合物用二乙醚洗滌 (二次)，將水相蒸發，用甲苯蒸餾 (二次) 除去殘餘的水，然後將所獲得的殘餘固體用己烷研製，得到 4-胺基-1-羥基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽，為奶油色固體 (13.1g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.48 (6H, s); 4.06 (2H, s); 5.32 (1H, s); 8.64 (3H, s).

步驟 3

在周圍溫度、氮氣氛下，在氫化鈉 (0.45g，於礦物油中之 80% 分散液) 於無水 DMF (2ml) 之攪拌過的懸浮劑中，於 5 分鐘期間逐滴加入步驟 2 產物 (0.75g) 於無水 DMF (20ml) 中之溶液。將混合物於周圍溫度下攪拌 2.75 小時，保存 18 小時，然後倒入水中，用二乙醚萃取 (三次) 並將有機萃取液合併。將合併的有機相用稀鹽酸萃取 (三次)，並將水性酸性萃取液合併並蒸發。將殘餘固體藉由在減壓下與甲苯一起蒸發 (二次) 而乾燥，得到 4-胺基-4-甲基-1-甲氧基戊-2-炔鹽酸鹽，為黃色膠 (0.8g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.78 (6H, s); 3.40 (3H, s); 4.12 (2H, s); 8.90 (3H, 寬信號).

實施例 13

本實施例係說明 2-(喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 16 之化合物編號 2) 之

製備

步驟 1

將 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯 (0.93g, 73% 純) 逐滴加到已經加熱到 80°C 之 6-羥基喹啉 (0.447g, 製備法見 *J. Chem. Soc.* 1952, 4985) 於含無水碳酸鉀 (0.845g) 之無水 DMF (5ml) 的溶液中。完成添加後，將混合物攪拌 0.5 小時，冷卻到周圍溫度並保存 2 天。將棕色懸浮劑用飽和氯化銨水溶液稀釋，並用乙酸乙酯萃取。將萃取液合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥及蒸發，得到紅色膠。此膠係經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用己烷/乙酸乙酯 (1:1 體積比) 洗提之層析純化，得到 2-(喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為紅色膠 (0.25g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.37 (3H, t); 2.25 (3H, s); 4.36 (2H, m); 5.75 (1H, s); 7.32 (1H, d); 7.71 (1H, dd); 8.02 (1H, d); 9.27 (1H, s); 9.33 (1H, s).

步驟 2

在步驟 1 產物 (0.24g) 於周圍溫度 THF (3ml) 之攪拌過的溶液中加入單水合氫氧化鋰 (0.040g) 於水 (1ml) 中之溶液。將混合物攪拌 1 小時，用稀硫酸酸化並用二乙醚萃取。將萃取液合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥及蒸發，得到 2-(喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，為棕色固體 (0.074g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.18 (3H, s); 5.18 (1H, s); 7.74 (1H, m); 7.79 (1H, dd); 7.99 (1H, d); 9.08 (1H, s);

9.41 (1H, s).

步驟 3

將三乙胺 (0.086ml) 加到 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽 (0.041g) 於無水 DMF (3ml) 之攪拌過的溶液中，得到白色懸浮劑。添加 1-HOBT (0.044g)，接著添加 EDC (0.060g)，然後添加步驟 2 產物 (0.074g) 於無水 DMF (1ml) 中之溶液。將白色懸浮劑於周圍溫度下攪拌 2 小時。將混合物用食鹽水稀釋並用乙酸乙酯萃取。將萃取液合併，用食鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後蒸發，得到棕色膠。此膠係經由矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯/己烷 (1:1 體積比) 洗提之層析純化，得到標題化合物，為淡棕色膠 (0.09g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (3H, s); 1.71 (3H, s); 1.82 (3H, s); 2.22 (3H, s); 5.65 (1H, s); 6.70 (1H, s); 7.37 (1H, m); 7.69 (1H, dd); 8.06 (1H, d); 9.28 (1H, s); 9.36 (1H, s).

實施例 14

本實施例係說明 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 1 之化合物編號 4) 之製備，此係經由對實施例 1 中所述者之一替代路徑進行。

步驟 1

將三乙胺 (1.84ml) 加到 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽 (1.278g) 於 DMF (5ml) 之攪拌過的溶液中，得到白色懸浮劑。然後將甲硫基乙酸 (1.0g) 於 DMF (5ml) 之溶液

加到此胺中，接著添加 HOBt (1.27g)，最後添加 EDC (1.806g)。將白色懸浮劑於周圍溫度下攪拌 6 小時，然後保存 18 小時。添加水，並用二乙醚萃取水相。將有機相合併，用水洗滌並經硫酸鎂乾燥，然後過濾及蒸發，得到 2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為橙黃色固體 (1.9g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.63 (6H, s); 1.82 (3H, s); 2.13 (3H, s); 3.14 (2H, s); 6.95 (NH, s).

步驟 2

將步驟 1 之產物 (0.824g) 伴隨溫熱溶解於四氯化碳 (15ml) 中。然後將溶液冷卻到 0°C ，然後逐漸地添加 N-氯琥珀醯亞胺 (NCS, 0.653g)，並將混合物於周圍溫度下攪拌 2 小時。將反應混合物過濾除去琥珀醯亞胺並將所得液體蒸發，得到 2-(氯)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為透明油 (1.4g)，其未經進一步純化即使用。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.64 (6H, s); 1.82 (3H, s); 2.29 (3H, s); 5.32 (1H, s); 6.57 (NH, s).

步驟 3

在 3,5-二氯酚 (0.163g) 於 DMF (8ml) 之攪拌過的溶液中加入碳酸鉀 (0.151g)，接著添加步驟 2 之產物 (0.20g)。將反應混合物於 80°C 攪拌 1 小時，冷卻到周圍溫度並保存 18 小時，然後於 80°C 攪拌另 3 小時。添加乙酸乙酯並用水洗滌混合物。將有機相分離，用水洗滌，接

著用稀氫氧化鈉水溶液 (10ml) 洗滌，然後將萃取液經硫酸鎂乾燥及蒸發，得到橙色油 (0.350g)。此經由於矽凝膠 (40-60 篩目) 上使用乙酸乙酯/己烷 (1:4 體積比) 洗提之急驟管柱層析純化，得到標題化合物，為橙色固體 (0.030g)。

以類似實施例 14 步驟 3 之程序，使 6-羥基苯并噁唑 (製備法敘述於 US 專利案第 6,130,217 號中) 與 2-氯-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺反應，得到 2-(苯并噁唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 38 之化合物 2)，為淡粉紅色膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.82 (3H, s); 2.20 (3H, s); 5.51 (1H, s); 6.76 (1H, s); 7.10 (1H, dd); 7.27 (1H, m); 7.72 (1H, d); 8.08 (1H, s).

實施例 15

本實施例係說明 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 1 之化合物編號 4) 之單一對映異構體的製備。

將 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺的消旋混合物經由以正己烷/丙-2-醇 (7:3 體積比) 洗提此消旋混合物通過製備型手性 hplc 管柱 [Chiralpac AD (Daicel 5cm x 50cm)] 而分離成二種單一對映異構體。測量這些單一對映異構體在丙-2-醇中的旋光性。異構體 A $+1.952^\circ$ 和異構體 B -1.949° 。

實施例 16

本實施例係說明 2-(2,6-二氯-4-吡啶氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 32 之化合物編號 11) 之製備

階段 1: 2-(2,6-二氯-4-吡啶氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯之製備

以類似實施例 4 步驟 2 之程序，使 2,6-二氯-4-羥基吡啶與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(2,6-二氯-4-吡啶氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為淡黃色油。

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(2,6-二氯-4-吡啶氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(2,6-二氯-4-吡啶氧基)-2-甲硫基乙酸，為黃色膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.24 (3H, s); 5.69 (1H, s); 6.94 (2H, s).

階段 2

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(2,6-二氯-4-吡啶氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(2,6-二氯-4-吡啶氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色固體，m. p. 141-142°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.67 (6H, s); 1.83 (3H, s); 2.20 (3H, s); 5.52 (1H, s); 6.46 (1H, s); 6.92 (2H, s).

實施例 17

本實施例係說明 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-乙硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 2 之化合物編號 4) 之製備

步驟 1

以類似實施例 4 步驟 2 之程序，使 3,5-二氯酚與 2-溴-2-乙硫基乙酸乙酯反應（以類似實施例步驟 1 中就 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯所述方法之程序從 2-乙硫基乙酸乙酯製得），得到 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-乙硫基乙酸乙酯，為黃色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.20 (3H, t); 1.33 (3H, t); 2.75 (2H, m); 4.31 (2H, m); 5.55 (1H, s); 6.91 (2H, d); 7.05 (1H, t).

以類似實施例 1 步驟 2 之程序，將 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-乙硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-乙硫基乙酸，為一種膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.27 (3H, m); 2.80 (2H, m); 5.60 (1H, s); 6.93 (2H, d); 7.07 (1H, t).

階段 2

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-乙硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽縮合，得到 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-乙硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.28 (3H, s); 1.66 (6H, s); 1.82 (3H, s); 2.27 (2H, m); 5.54 (1H, s); 6.54 (1H, s); 6.92 (2H, d); 7.08 (1H, m).

實施例 18

本實施例係說明 2-(苯并異噁唑基-5-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺（表 40 之化合物編號 2

) 之製備

將在 5-羥基苯并異噁唑 (0.15g, 製備法係敘述於 *J. Heterocyclic Chem* (1986), 27, 897 中) 於無水 1,4-二噁烷 (3ml) 之攪拌過的溶液中加入氫化鈉 (0.049g, 於礦物油中之 60% 分散液)。當泡騰已經停止, 添加 2-氯-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (0.229g) 於 1,4-二噁烷 (2ml) 中之溶液, 並將混合物於周圍溫度下攪拌 8 小時, 然後保存 2 天。將混合物倒入稀鹽酸水溶液中, 並用二乙醚萃取。將有機相分離, 用水洗滌, 經硫酸鎂乾燥及在減壓下蒸發, 得到棕色膠, 其係經由層析 (二氧化矽; $\text{CHCl}_3/\text{MeOH}$, 9:1 體積比) 分級, 得到 2-(苯并異噁唑基-5-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺, 為棕色膠, 0.053g。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.69 (3H, s); 1.82 (3H, s); 2.20 (3H, s); 5.46 (1H, s); 6.63 (1H, s); 6.88 (1H, m); 7.11 (1H, dd); 7.71 (1H, d); 9.02 (1H, s).

實施例 19

本實施例係說明 2-(3,8-二溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 26 之化合物編號 2) 之製備

階段 1: 3,8-二溴-6-羥基喹啉之製備

步驟 1: 6-胺基-3,8-二溴喹啉之製備

將 3,8-二溴-6-硝基喹啉 (48.5g, 如 *J Am Chem Soc* (1955), 77, 4175-4176 中所述者製備) 懸浮於周圍溫度濃

鹽酸 (400ml) 中，並將鐵粉 (27g，用氫還原) 分幾部分添加，使反應溫度在添加期間上升到 73°C。最初製備的亮黃色懸浮劑在反應最終階段期間變成深棕色。將混合物冷卻到 0°C，並用氫氧化鈉水溶液 (10M) 鹼化，直到反應於 pH 10。將乙酸乙酯加到懸浮劑中，並將混合物徹底混合，然後經由矽藻土床過濾。將有機部分分離，並用另外的乙酸乙酯再萃取水性部分。將從溶液過濾得到的不溶物質進一步用熱丙酮萃取，並將有機部分合併，用碳酸氫鈉水溶液洗滌，經硫酸鈉乾燥及在減壓下蒸發，得到 6-氨基-3,8-二溴喹啉，為棕色固體，34.7g。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 4.09 (2H, s); 6.76 (1H, s); 7.52 (1H, s); 8.03 (1H, s); 8.71 (1H, s).

步驟 2: 3,8-二溴-6-羥基喹啉之製備

將 6-氨基-3,8-二溴喹啉 (1.1g) 懸浮於含水 (10ml) 之磷酸 (10ml) 中，並在密封玻璃管中於 180°C 加熱 4 天。將混合物冷卻到周圍溫度，倒入食鹽水中並用乙酸乙酯萃取。將有機萃取液，經硫酸鎂乾燥，在減壓下蒸發，殘餘固體經由層析 (二氧化矽; 己烷/乙酸乙酯) 分級，得到 3,8-二溴-6-羥基喹啉，0.4g，為淺棕色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 6.97 (1H, s); 7.69 (1H, s); 8.09 (1H, s); 8.72 (1H, s).

階段 2

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，使 3,8-二溴-6-羥基喹啉與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(3,8-二溴喹

啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為淡黃色膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.36 (3H, t); 2.24 (3H, s); 4.29-4.41 (2H, m); 5.69 (1H, s); 7.12 (1H, d); 7.88 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.89 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(3,8-二溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(3,8-二溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，為淡黃色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.26 (3H, s); 5.71 (1H, s); 7.17 (1H, d); 7.89 (1H, d); 8.27 (1H, d); 8.88 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(3,8-二溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(3,8-二溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色固體，m.p. 178-179°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.70 (3H, s); 1.84 (3H, s); 2.21 (3H, s); 5.60 (1H, s); 6.66 (1H, s); 7.17 (1H, d); 7.85 (1H, d); 8.27 (1H, d); 8.91 (1H, s).

實施例 20

本實施例係說明 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 20 之化合物編號 2) 之製備

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，使 3-溴-6-羥基喹啉 (製備法係敘述於 *Liebigs Ann Chem* (1966), 98-106) 與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為淡黃色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.34 (3H, t); 2.24 (3H, s); 4.30-4.38 (2H, m); 5.70 (1H, s); 7.14 (1H, m); 7.48-7.52 (1H, dd); 8.02 (1H, d); 8.22 (1H, s); 8.80 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯轉化成 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，無色固體，m. p. 166-167°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.26 (3H, s); 5.76 (1H, s); 7.20 (1H, m); 7.50-7.54 (1H, dd); 8.01 (1H, d); 8.28 (1H, s); 8.78 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色固體，m. p. 135-137°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (3H, s); 1.71 (3H, s); 1.83 (3H, s); 2.22 (3H, s); 5.62 (1H, s); 6.72 (1H, s); 7.18 (1H, d); 7.47 (1H, dd); 8.05 (1H, d); 8.24 (1H, d); 8.82 (1H, m).

實施例 21

本實施例係說明 2-(3-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 23 之化合物編號 2) 之製備

階段 1: 3-氯-6-羥基喹啉之製備

在 3-溴-6-羥基喹啉 (1.0g) 於 N-甲基-2-吡咯烷酮 (12ml, 已經由將氮氣成泡吹過溶液去氧) 之攪拌過的溶液

中加入氯化銅(1) (1.10g) 和氯化鉀 (1.66g) 。在氮氣氛下將混合物加熱到 120°C 維持 2 小時，然後在 170°C 下 2 小時。將反應用飽和氯化銨水溶液稀釋，添加乙酸乙酯並攪拌混合物以溶解所需的產物。將混合物過濾除去不溶物質，並將有機相分離。將水相用乙酸乙酯萃取 (三次)，並用溫乙酸乙酯洗滌不溶物質。將乙酸乙酯部分合併，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後在減壓下蒸發，得到固體。此固體係經由層析 (二氧化矽；乙酸乙酯/己烷 9:1 體積比) 分級，得到 3-氯-6-羥基喹啉，0.7g，為無色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 7.06 (1H, d); 7.35 (1H, dd); 7.91 (1H, d); 7.96 (1H, d); 8.59 (1H, d); 9.55 (1H, s).

階段 2

以類似實施例 18 之程序，使 3-氯-6-羥基喹啉與 2-氯-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺反應，得到 2-(3-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色固體，m. p. 105°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (3H, s); 1.71 (3H, s); 1.83 (3H, s); 2.22 (3H, s); 5.62 (1H, s); 6.72 (1H, s); 7.20 (1H, d); 7.47 (1H, dd); 8.07 (1H, d); 8.08 (1H, s); 8.73 (1H, d).

實施例 22

本實施例係說明 2-(3-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 22 之化合物編號 2) 之製備

步驟 1：3-氟-6-羥基喹啉之製備

在於氮氣氛下已冷卻到 -78°C 之 3-溴-6-羥基喹啉 (0.67g) 於無水四氫呋喃 (15ml) 之攪拌過的溶液中，逐滴加入正丁基鋰溶液 (2.4ml, 2.5M 己烷溶液)，使得反應維持在 -72°C 以下。將所製得之橙色懸浮劑於 -78°C 下攪拌，並逐滴加入 N-氟苯磺醯亞胺 (0.97g) 於四氫呋喃 (10ml) 中之溶液，並於添加期間將反應維持在 -68°C 以下。將所形成的紅色溶液攪拌，使反應逐漸到達周圍溫度。將反應用水處理，然後用鹽酸水溶液使之成 pH 4-5。將所形成的乳劑用乙酸乙酯萃取，分離，並將有機相用食鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥及在減壓下蒸發。殘餘的膠係經由層析 (二氧化矽；己烷/乙酸乙酯) 分級，得到含所欲產物的橙色固體。

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，使 3-氟-6-羥基喹啉與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(3-氟喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為一種膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.35 (3H, t); 2.24 (3H, s); 4.29-4.40 (2H, m); 5.71 (1H, s); 7.20 (1H, d); 7.46 (1H, dd); 7.69 (1H, dd); 8.07 (1H, d); 8.71 (1H, dd).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(3-氟喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(3-氟喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，為淡黃色固體，其係未經進一步純化即用於下一步驟。

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(3-氟喹啉基-6-

氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(3-氟喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.70 (3H, s); 1.83 (3H, s); 2.21 (3H, s); 5.62 (1H, s); 6.72 (1H, s); 7.23 (1H, d); 7.42 (1H, dd); 7.71 (1H, dd); 8.09 (1H, d); 8.71 (1H, d).

實施例 23

本實施例係說明 2-(異喹啉基-7-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 18 之化合物編號 2) 之製備

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，使 7-羥基異喹啉 (市售) 與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(異喹啉基-7-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為紅色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.37 (3H, t); 2.25 (3H, s); 4.30-4.42 (2H, m); 5.75 (1H, s); 7.37 (1H, m); 7.50 (1H, dd); 7.62 (1H, dd); 7.80 (1H, d); 8.47 (1H, d); 9.18 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(異喹啉基-7-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解成 2-(異喹啉基-7-氧基)-2-甲硫基乙酸，淡棕色固體。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.17 (3H, s); 6.22 (1H, s); 7.92 (1H, dd); 7.97 (1H, d); 8.27 (1H, d); 8.37 (1H, d); 8.58 (1H, d); 9.66 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(異喹啉基-7-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(異喹啉基-7-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為灰白色固體，m. p. 167-168°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.69 (3H, s); 1.82 (3H, s); 2.22 (3H, s); 5.65 (1H, s); 6.73 (1H, s); 7.42 (1H, m); 7.46 (1H, dd); 7.62 (1H, d); 7.82 (1H, d); 8.49 (1H, d); 9.19 (1H, s).

實施例 24

本實施例係說明 2-(異喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 27 之化合物編號 2) 之製備

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，使 6-羥基異喹啉 (製備法係敘述於 *J. Org. Chem.* (1953), 18, 3345) 與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(異喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為橙色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.36 (3H, t); 2.25 (3H, s); 4.29-4.42 (2H, m); 5.76 (1H, s); 7.20 (1H, m); 7.38 (1H, dd); 7.57 (1H, d); 7.93 (1H, d); 8.48 (1H, d); 9.15 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(異喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解成 2-(異喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸。此酸係經由使水溶液成微酸性 (pH 5) 並藉由在減壓下蒸發來除去水而獲得。所需的酸和無機殘餘物未

經進一步純化即直接用於下一步驟。

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.19 (3H, s); 5.67 (1H, s); 7.03 (1H, d); 7.23 (1H, dd); 7.49 (1H, d); 7.82 (1H, d); 8.18 (1H, d); 8.87 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(異喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(異喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.69 (3H, s); 1.82 (3H, s); 2.21 (3H, s); 5.67 (1H, s); 6.74 (1H, s); 7.25 (1H, m); 7.35 (1H, dd); 7.58 (1H, d); 7.96 (1H, d); 8.49 (1H, d); 9.17 (1H, s).

實施例 25

本實施例係說明 2-(2,1,3-苯并噁二唑基-5-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 41 之化合物編號 2) 之製備

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，使 5-羥基-2,1,3-苯并噁二唑 (市售) 與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(2,1,3-苯并噁二唑基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為淡黃色固體，m. p. 77-79°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.36 (3H, t); 2.26 (3H, s); 4.32-4.38 (2H, q); 5.64 (1H, s); 6.98 (1H, m); 7.22-7.26 (1H, dd); 7.78 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(2,1,3-苯并噁

二唑基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(2,1,3-苯并噁二唑基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸，為一種膠。

^1H NMR (DMSO- d_6) δ ppm: 2.30 (3H, s); 5.72 (1H, s); 7.06 (1H, d); 7.22-7.26 (1H, dd); 7.82 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(2,1,3-苯并噁二唑基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(2,1,3-苯并噁二唑基-5-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為淡棕色固體，m. p. 120-122°C。

^1H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.70 (3H, s); 1.82 (3H, s); 2.22 (3H, s); 5.58 (1H, s); 6.56 (1H, s); 7.06 (1H, m); 7.24 (1H, dd); 7.82 (1H, d).

實施例 26

本實施例係說明 2-(2-溴苯并噁唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 43 之化合物編號 2) 之製備

階段 1: 2-溴-6-羥基苯并噁唑之製備

步驟 1

以類似於 US 專利案第 4873346 號中就 2-氯-6-甲氧基苯并噁唑製備所敘述之程序，使用溴化銅(1)代替氯化銅(1)，將 2-胺基-6-甲氧基苯并噁唑 (市售) 轉化成 2-溴-6-甲氧基苯并噁唑 (淡黃色固體，m. p. 53-54°C)。

步驟 2

在於氮氣氛下、周圍溫度之 2-溴-6-甲氧基苯并噁唑

(0.67g) 於無水二氯甲烷 (30ml) 之攪拌過的溶液中，逐滴加入三溴化硼於二氯甲烷中之溶液 (5.5ml, 1M)。將混合物於周圍溫度下攪拌 2 小時，保存 2 天，然後倒入水中。將有機相分離，用水洗滌，經硫酸鎂乾燥，然後在減壓下蒸發，得到 2-溴-6-羥基苯并噻唑，為淡粉紅色固體，0.60g, m. p. 203-204°C。

以類似實施例 5 步驟 1 之程序，使 2-溴-6-羥基苯并噻唑與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(2-溴苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為淡黃色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.36 (3H, t); 2.24 (3H, s); 4.30-4.36 (2H, q); 5.62 (1H, s); 7.20 (1H, dd); 7.42 (1H, d); 7.92 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(2-溴苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(2-溴苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，為淡黃色膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.26 (3H, s); 5.70 (1H, s); 7.22 (1H, dd); 7.46 (1H, d); 7.94 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(2-溴苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(2-溴苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.69 (6H, s); 1.82 (3H, s); 2.19 (3H, s); 5.52 (1H, s); 6.73 (1H, s); 7.18 (1H, dd); 7.44 (1H, dd); 7.93 (1H, d).

實施例 27

本實施例係說明 2-(2-氯苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 42 之化合物編號 2) 之製備

以類似於實施例 5 步驟 1 之程序，使 2-氯-6-羥基苯并噻唑 (製備法係敘述於 US 專利案第 4873346 號中) 與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(2-氯苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為淡棕色油。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.34 (3H, t); 2.22 (3H, s); 4.30-4.36 (2H, q); 5.62 (1H, s); 7.20 (1H, dd); 7.40 (1H, d); 7.88 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(2-氯苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(2-氯苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，為淡橙色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.26 (3H, s); 5.68 (1H, s); 7.22 (1H, dd); 7.42 (1H, d); 7.92 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(2-氯苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(2-氯苯并噻唑-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為淡黃色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.84 (3H, s); 2.18 (3H, s); 5.52 (1H, s); 6.72 (1H, s); 7.20 (1H, dd); 7.42 (1H, dd); 7.90 (1H, d).

實施例 28

本實施例係說明 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺 (表 20 之化合物編號 90) 之製備

階段 1: 鹽酸 1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基胺之製備

步驟 1: 6-(1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷之製備

於 0.5 小時期間將正丁基鋰的溶液 (97.6ml, 2.5M 己烷溶液) 逐滴添加到 -70°C 於氮氣氛下之 1-(1,1-二甲基-2-丙炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷 (55.1g) 於無水四氫呋喃 (450ml) 之攪拌過的溶液中。將混合物於 -70°C 攪拌 1.5 小時, 使其溫熱到 -15°C , 然後於 20 分鐘期間逐滴加入 1-氯-3-碘丙烷 (55.0g) 於無水四氫呋喃 (50ml) 中之溶液, 同時使反應溫度慢慢地溫熱到 0°C 。完成添加後, 將反應混合物於周圍溫度下攪拌 4.25 小時, 然後保存 18 小時。將混合物用水稀釋並用乙酸乙酯萃取 (二次)。將萃取液合併, 用水洗滌 (三次), 經硫酸鎂乾燥, 然後在減壓下蒸發, 得到所需的產物, 為橙色液體, 78.5g。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 0.00 (12H, s); 0.46 (4H, s); 1.30 (6H, s); 1.76 (2H, m); 2.18 (2H, t); 2.46 (2H, t).

步驟 2: 鹽酸 1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基胺之製備

將步驟 1 之產物 (78.5g) 於 -5°C 下攪拌並慢慢地添加稀鹽酸水溶液 (785ml, 2M), 在添加期間將反應溫度維持在 30°C 以下。完成添加後, 將混合物於周圍溫度下攪拌

另 1 小時，用二乙醚洗滌（二次），在減壓下蒸發，殘餘水則藉由與甲苯一起共沸蒸餾除去。將所獲得的固體溶解於二氯甲烷中，經硫酸鎂乾燥及在減壓下蒸發，得到所需的產物，為奶油色固體，36.5g。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.74 (6H, s); 1.97 (2H, m); 2.39 (2H, m); 3.68 (2H, t); 8.80 (3H, 寬信號).

階段 2:

以類似實施例 1 步驟 3 之程序，使 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與鹽酸 1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基胺縮合，得到 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺，為黃色固體，m. p. 133-135°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.95 (2H, q); 2.22 (3H, s); 2.40 (2H, t); 3.68 (2H, t); 5.62 (1H, s); 6.68 (1H, s); 7.18 (1H, m); 7.48 (1H, dd); 8.04 (1H, d); 8.26 (1H, m); 8.82 (1H, d).

實施例 29

本實施例係說明 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺（表 20 之化合物編號 21）之製備

在 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氯-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺（0.61g）於無水 N,N-二甲基甲醯胺（10ml）之攪拌過的溶液中加入氫化鉀（0.17g），並將混合物加熱到 100°C 維持 6.25 小時，冷卻到周圍溫度，然後

保存 18 小時。將反應混合物倒入水中，用乙酸乙酯萃取（三次），並將萃取液合併，用水洗滌（二次），經硫酸鎂乾燥及在減壓下蒸發，得到油。此油係經由層析（二氧化矽；己烷/乙酸乙酯，1：1 體積比）分級，得到 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氟基-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺，為黃色固體，0.27g，m. p. 140-141°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (6H, s); 1.86 (2H, q); 2.22 (3H, s); 2.40 (2H, t); 3.66 (2H, t); 5.62 (1H, s); 6.68 (1H, s); 7.18 (1H, m); 7.48 (1H, dd); 8.04 (1H, d); 8.26 (1H, m); 8.82 (1H, d).

以類似實施例 29 之程序，使 2-(苯并噁唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氟-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺與氰化鉀反應，得到 2-(苯并噁唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氟基-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺（表 34 之化合物編號 21），為黃色膠。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (6H, s); 1.82-1.90 (2H, m); 2.22 (3H, s); 2.40 (2H, t); 2.56 (2H, t); 5.54 (1H, s); 6.72 (1H, s); 7.24 (1H, dd); 7.58 (1H, d); 8.09 (1H, d); 8.92 (1H, s).

以類似實施例 29 之程序，使 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氟-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺與氰化鉀反應，得到 2-(5-氯吡啶基-3-氧基)-2-甲硫基-N-(1-氟基-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺（表 31 之化合物編號 148），為黃色油。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.70 (3H, s); 1.82-1.90 (2H, m); 2.16 (3H, s); 2.38-2.42 (2H, t); 2.54-2.58 (2H, t); 5.50 (1H, s); 6.62 (1H, s); 7.38 (1H, m); 8.31 (2H, m).

實施例 30

本實施例係說明 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-甲硫基-N-(1-氰基-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺 (表 13 之化合物編號 4) 之製備

階段 1: 6-胺基-1-氰基-6-甲基庚-4-炔鹽酸鹽之製備

在 6-(1-氰-6-甲基庚-4-炔-6-基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷 (1.00g) 於無水 N,N-二甲基甲醯胺 (10ml) 之攪拌過的溶液中加入氰化鉀 (0.21g), 並將混合物加熱到 90°C 維持 18 小時, 然後冷卻到周圍溫度。將混合物倒入水中, 用乙酸乙酯萃取 (三次), 將萃取液合併, 用水洗滌 (三次), 經硫酸鎂乾燥及在減壓下蒸發, 得到 6-(1-氰基-6-甲基庚-4-炔-6-基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮雜-2,5-二矽雜環戊烷, 為紅色油, 0.95g。

將該油與鹽酸水溶液 (9.5ml, 2M) 混合, 並於周圍溫度下攪拌 1.25 小時。將水相用二乙醚洗滌 (二次), 然後在減壓下蒸發, 藉由與甲苯一起共沸蒸餾除去最後微量的水, 得到 6-胺基-1-氰基-6-甲基庚-4-炔鹽酸鹽, 為黃色固體, 0.59g。

階段 2:

以類似實施例 1 步驟 3 之程序, 使 2-(3,5-二氯苯氧

基)-2-甲硫基乙酸與鹽酸 1-氟基-6-甲基庚-4-炔-6-基胺縮合，得到 2-(3,5-二氯苯氧基)-2-甲硫基-N-(1-氟基-6-甲基庚-4-炔-6-基)乙醯胺，為灰白色固體，m. p. 113-114°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.66 (6H, s); 1.82-1.90 (2H, m); 2.16 (3H, s); 2.40 (2H, t); 2.54 (2H, t); 5.44 (1H, s); 6.56 (1H, s); 6.94 (2H, d); 7.10 (1H, m).

實施例 31

本實施例係說明 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 44 之化合物編號 2) 之製備

步驟 1: 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯之製備

在於周圍溫度、氮氣氛下之氫化鈉 (0.32g, 80% 於礦物油中) 於無水 N,N 二甲基甲醯胺 (10ml) 之攪拌過的懸浮劑中，於 10 分鐘期間加入 2-甲胺基-6-羥基苯并噻唑 (製備法見 *J. Org. Chem.* (1970), 35, No.12, 4103-4108; 1.08g) 於 N,N 二甲基甲醯胺中之溶液。將反應混合物攪拌 0.5 小時，然後於 5 分鐘期間添加 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯 (2.60g) 於 N,N 二甲基甲醯胺 (10ml) 中之溶液，並將混合物攪拌 2 小時，然後在周圍溫度下保存 18 小時。添加水並將產物萃取至乙酸乙酯中 (三次)。將萃取液合併，用食鹽水洗滌 (二次)，經硫酸鎂乾燥及在減壓下蒸發，得到油。此油係經由層析 (二氧化矽; 己烷/乙酸乙酯

(95 : 5 至 5 : 95 體積比)) 分級，得到 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為深橙色膠，0.97g。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.34 (3H, t); 2.22 (3H, s); 3.10 (3H, s); 4.28-4.36 (2H, m); 5.38 (1H, bs); 5.54 (1H, s); 7.02 (1H, dd); 7.30 (1H, m); 7.46 (1H, d).

步驟 2 : 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸之製備

以類似實施例 1 步驟 2 之程序，將 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，為淡棕色固體，m. p. 115-118°C。

$^1\text{H NMR}$ (d_6 -DMSO) δ ppm: 2.06 (3H, s); 2.84 (3H, s); 5.76 (1H, s); 6.88 (1H, dd); 7.24 (1H, d); 7.36 (1H, m).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽縮合，得到 2-(2-甲胺基苯并噻唑基-6-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為淡黃色固體，m. p. 68-71°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.70 (3H, s); 1.84 (3H, s); 2.18 (3H, s); 3.12 (3H, s); 5.25 (1H, bs); 5.42 (1H, s); 6.78 (1H, bs); 6.98-7.02 (1H, dd); 7.28 (1H, m); 7.47-7.51 (1H, d).

實施例 32

本實施例係說明 2-(3-溴-8-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫

基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 25 之化合物編號 2) 之製備

以類似於實施例 19 步驟 2 之程序，將 6-氨基-3-溴-8-氯喹啉 [製備法見於 *J Am Chem Soc* (1955), 77, 4175-4176) 水解，得到 3-溴-8-氯-6-羥基喹啉，為棕色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 7.00 (1H, d); 7.52 (1H, d); 8.17 (1H, d); 8.77 (1H, d); 於 7ppm 有非常寬的 OH 信號。

以類似於實施例 5 步驟 1 之程序，使 3-溴-8-氯-6-羥基喹啉與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(3-溴-8-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯，為黃色膠。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.37 (3H, t); 2.23 (3H, s); 4.28-4.40 (2H, m); 5.69 (1H, s); 7.08 (1H, d); 7.68 (1H, d); 8.25 (1H, d); 8.90 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(3-溴-8-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解成 2-(3-溴-8-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸，為無色固體。

$^1\text{H NMR}$ (d_6 -DMSO) δ ppm: 2.17 (3H, s); 6.16 (1H, s); 7.52 (1H, d); 7.86 (1H, d); 8.68 (1H, d); 8.93 (1H, d).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(3-溴-8-氯喹啉基-6-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-氨基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽縮合，得到 2-(3-溴-8-氯喹啉基-6-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺，為無色固體，m. p. 166-167°C。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.83 (3H, s); 2.21 (3H, s); 5.60 (1H, s); 6.66 (1H, bs); 7.12 (1H, d); 7.64 (1H, d); 8.28 (1H, d); 8.92 (1H, d).

實施例 33

本實施例係說明 2-(1-甲基吡啶基-5-氧基)-2-甲硫基-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺 (表 45 之化合物編號 2) 之製備

步驟 1: 5-胺基-1-甲基吡啶之製備

在 1-甲基-5-硝基吡啶 (3.24g, 市售) 於濃鹽酸 (75ml) 之攪拌過的溶液中, 於 10 分鐘期間將鐵粉 (3.53g) 分幾部分加入, 使反應溫度逐漸地上升到 52°C 。完成添加後, 將反應混合物加熱到 $70-75^\circ\text{C}$ 維持 1 小時, 冷卻到周圍溫度並保存 18 小時。藉由添加冰塊冷卻混合物, 然後用氫氧化鈉水溶液使之成 pH 9, 過濾並將濾液和不溶固體用乙酸乙酯萃取 (三次)。將萃取液合併, 用食鹽水洗滌並經硫酸鎂乾燥, 然後在減壓下蒸發, 得到 5-胺基-1-甲基吡啶, 為淡棕色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 3.92 (3H, s); 4.80 (2H, s); 6.74 (1H, m); 6.82 (1H, dd); 7.32 (1H, d); 7.66 (1H, s).

將 5-胺基-1-甲基吡啶 (1.56g) 於含水 (3ml) 之磷酸 (13ml) 中之溶液加熱到 180°C 維持 18 小時, 冷卻到周圍溫度, 倒入水 (5ml) 中, 然後用氫氧化鈉水溶液中和。將沈澱的固體從溶液中過濾出來, 用冷水洗滌, 然後抽氣到乾燥, 水解, 得到 5-羥基-1-甲基吡啶, 為棕色固體,

(1.18g)。

^1H NMR (d_6 -DMSO) δ ppm: 3.96 (3H, s); 6.94 (2H, m); 7.44 (1H, d); 7.80 (1H, s); 9.14 (1H, s).

以類似於實施例 31 步驟 1 之程序，使 5-羥基-1-甲基吡啶與 2-溴-2-甲硫基乙酸乙酯反應，得到 2-(1-甲基吡啶基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.36 (3H, t); 2.24 (3H, s); 4.06 (3H, s); 4.30-4.38 (2H, m); 5.58 (1H, s); 7.20 (1H, dd); 7.26 (1H, s); 7.36 (1H, d); 7.90 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 2 之程序，將 2-(1-甲基吡啶基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸乙酯水解，得到 2-(1-甲基吡啶基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸。

^1H NMR (d_6 -DMSO) δ ppm: 2.26 (3H, s); 4.06 (3H, s); 5.60 (1H, s); 7.22 (1H, dd); 7.28 (1H, d); 7.36 (1H, d); 7.92 (1H, s).

以類似實施例 5 步驟 3 之程序，將 2-(1-甲基吡啶基-5-氧基)-2-甲硫基乙酸與 4-胺基-4-甲基戊-2-炔縮合，得到 2-(1-甲基吡啶基-5-氧基)-2-(甲硫基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.68 (3H, s); 1.70 (3H, s); 1.83 (3H, s); 2.18 (3H, s); 4.06 (3H, s); 5.46 (1H, s); 6.81 (1H, s); 7.16 (1H, dd); 7.30 (1H, d); 7.36 (1H, d); 7.92 (1H, s).

表 142

此表列出列於表 1 至 129 之化合物的特徵數據 (NMR, 熔點或折射率)。

化合物編號	表編號	(溶劑 CDCl ₃): 距離 TMS 之 ¹ H NMR 化學位移, 以 ppm 表示, 或熔點(mpt)或折射率(n _D ³⁰)
2	1	1.68 (6H,s); 1.83 (3H,s); 2.16 (3H,s); 5.41 (1H,s); 6.85 (1H,bs); 7.09 (2H,s).
2	14	1.69 (3H,s); 1.70 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.22 (3H,s); 5.64 (1H,s); 6.76 (1H,s); 7.28 (1H,d); 7.40 (1H,dd); 7.47 (1H,dd); 8.09 (1H,m); 8.84 (1H,dd).
2	16	1.70 (3H,s); 1.71 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.22 (3H,s); 5.65 (1H,s); 6.70 (1H,s); 7.37 (1H,m); 7.69 (1H,dd); 8.06 (1H,d); 9.28 (1H,s); 9.36 (1H,s).
2	18	1.68 (3H,s); 1.69 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.22 (3H,s); 5.65 (1H,s); 6.73 (1H,s); 7.42 (1H,m); 7.46 (1H,dd); 7.62 (1H,d); 7.82 (1H,d); 8.49 (1H,d); 9.19 (1H,s).
2	20	1.70 (3H,s); 1.71 (3H,s); 1.83 (3H,s); 2.22 (3H,s); 5.62 (1H,s); 6.72 (1H,s); 7.18 (1H,d); 7.47 (1H,dd); 8.05 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.82 (1H,m).
2	22	1.68 (3H,s); 1.70 (3H,s); 1.83 (3H,s); 2.21 (3H,s); 5.62 (1H,s); 6.72 (1H,s); 7.23 (1H,d); 7.42 (1H,dd); 7.71 (1H,dd); 8.09 (1H,d); 8.71 (1H,d).
2	23	1.70 (3H,s); 1.71 (3H,s); 1.83 (3H,s); 2.22 (3H,s); 5.62 (1H,s); 6.72 (1H,s); 7.20 (1H,d); 7.47 (1H,dd); 8.07 (1H,d); 8.08 (1H,s); 8.73 (1H,d).
2	25	1.70 (6H,s); 1.83 (3H,s); 2.21 (3H,s); 5.60 (1H,s); 6.66 (1H,bs); 7.12 (1H,d); 7.64 (1H,d); 8.28 (1H,d); 8.92 (1H,d).
2	26	1.68 (3H,s); 1.70 (3H,s); 1.84 (3H,s); 2.21 (3H,s); 5.60 (1H,s); 6.66 (1H,s); 7.17 (1H,d); 7.85 (1H,d); 8.27 (1H,d); 8.91 (1H,s).
2	27	1.68 (3H,s); 1.69 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.21 (3H,s); 5.67 (1H,s); 6.74 (1H,s); 7.25 (1H,m); 7.35 (1H,dd); 7.58 (1H,d); 7.96 (1H,d); 8.49 (1H,d); 9.17 (1H,s).
2	31	1.72 (6H,s); 1.82 (3H,s); 2.20 (3H,s); 5.51 (1H,s); 6.76 (1H,s); 7.10 (1H,dd); 7.27 (1H,m); 7.72 (1H,d); 8.07 (1H,s).
2	34	1.78 (3H,s); 1.80 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.20 (3H,s); 5.54 (1H,s); 6.77 (1H,bs); 7.23 (1H,dd); 7.58 (1H,m); 8.09 (1H,d); 8.92 (1H,s).
2	38	1.70 (6H,s); 1.82 (3H,s); 2.20 (3H,s); 5.51 (1H,s); 6.67 (1H,s); 7.10 (1H,dd); 7.27 (1H,m); 7.72 (1H,d); 8.08 (1H,s).
2	41	1.70 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.22 (3H,s); 5.58 (1H,s); 6.56 (1H,s); 7.06 (1H,m); 7.24 (1H,dd); 7.72 (1H,d).
2	42	1.70 (6H,s); 1.84 (3H,s); 2.18 (3H,s); 5.52 (1H,s); 6.72 (1H,s); 7.20 (1H,dd); 7.42 (1H,dd); 7.90 (1H,d).
2	43	1.69 (6H,s); 1.82 (3H,s); 2.19 (3H,s); 5.52 (1H,s); 6.73 (1H,s); 7.18 (1H,dd); 7.44 (1H,dd); 7.93 (1H,d).
2	44	1.70 (3H,s); 1.84 (3H,s); 2.18 (3H,s); 3.12 (3H,s); 5.25 (1H,bs); 5.42 (1H,s); 6.78 (1H,bs); 6.98-7.02 (1H,dd); 7.28 (1H,m); 7.47-7.51 (1H,d).
2	45	1.68 (3H,s); 1.70 (3H,s); 1.84 (3H,s); 2.18 (3H,s); 4.06 (3H,s); 5.46 (1H,s); 6.81 (1H,s); 7.16 (1H,dd); 7.30 (1H,d); 7.36 (1H,d); 7.92 (1H,s).
2	81	1.67 (3H,s); 1.69 (3H,s); 1.80(s)和 1.82(s)總共 3H; 2.72(s)和 2.83 總

		共 3H; 5.28(s)和 5.53(s)總共 1H; 6.81(s)和 6.94(s)總共 1H; 7.29(dd)和 7.33(dd)總共 1H; 7.67(m)和 7.79(m)總共 1H; 8.09(m)和 8.94(m)總共 1H.
3	1	1.67 (3H,s); 1.68 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.11 (3H,s); 2.15 (3H,s); 2.27 (6H,s); 5.43 (1H,s); 6.67 (2H,m); 7.77 (1H,bs).
3	31	1.70 (6H,s); 1.84 (3H,s); 2.18 (3H,s); 5.48 (1H,s); 6.62 (1H,bs); 7.38 (1H,m); 8.30-8.32(2H,m).
3	78	1.66 (6H,s); 1.82 (3H,s); 2.70(s)和 2.82(s)總共 3H; 5.22(s)和 5.46(s)總共 1H; 6.68(s)和 6.88(s)總共 1H; 7.44(m)和 7.5(m)總共 1H; 8.36-8.42 (2H,m).
4	1	1.68 (6H,s); 1.83 (3H,s); 2.16 (3H,s); 5.42 (1H,s); 6.58 (1H,bs); 6.94 (2H,d); 7.09 (1H,t).
4	2	1.28 (3H,s); 1.66 (6H,s); 1.82 (3H,s); 2.27 (2H,m); 5.44 (1H,s); 6.54 (1H,s); 6.92 (2H,d); 7.08 (1H,m).
4	7	1.71 (6H,s); 2.16 (3H,s); 3.38 (3H,s); 4.12 (2H,s); 5.44 (1H,s); 6.59 (1H,bs); 6.93 (2H,s); 7.10 (1H,s).
4	13	1.66 (6H,s); 1.82-1.90 (2H,m); 2.16 (3H,s); 2.40 (2H,t); 2.54 (2H,t); 5.44 (1H,s); 6.56 (1H,s); 6.94 (2H,d); 7.10 (1H,m).
4	48	1.62, 1.64, 1.65 (4x3H,3s); 1.80 和 1.81 (2x3H,2s); 2.67 和 2.77 (2x3H,2s); 5.18 和 5.40 (2H,2s); 6.64 和 6.82 (2H,2bs); 6.98 和 7.06 (2x2H,2s); 7.10 和 7.12 (2H,2s).
4	54	1.67, 1.69 和 1.70 (4x3H,3s); 2.69 和 2.77 (2x3H,2s); 3.37 (3H,s); 4.11 (2H,s); 5.19 和 5.36 (2H,2s); 6.63 和 6.86 (2H,2bs); 6.98 和 7.06 (2x2H,2s); 7.13 和 7.14 (2H,2s).
4	95	1.66 (3H,s); 1.67 (3H,s); 1.82 (3H,s); 3.14 (3H,s); 5.27 (1H,s); 6.73 (1H,bs); 7.04 (2H,d); 7.15 (1H,t).
4	101	1.68 (3H,s); 1.70 (3H,s); 3.13 (3H,s); 3.35 (3H,s); 4.10 (2H,s); 5.30 (1H,s); 6.78 (1H,bs); 7.02 (2H,s); 7.13 (1H,s).
9	1	1.67 (3H,s); 1.68 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.15 (3H,s); 2.36 (6H,s); 5.42 (3H,s); 6.71 (1H,bs); 6.75 (2H,s).
11	32	1.67 (6H,s); 1.83 (3H,s); 2.20 (3H,s); 5.52 (1H,s); 6.46 (1H,s); 6.92 (2H,s).
12	1	1.67 (3H,s); 1.68 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.18 (3H,s); 3.78 (6H,s); 5.46 (1H,s); 6.19 (3H,s); 6.70 (1H,bs).
12	20	1.73 (6H,s); 2.21 (3H,s); 3.38 (3H,s); 4.12 (2H,s); 5.62 (1H,s); 6.72 (1H,s); 7.18 (1H,d); 7.74 (1H,dd); 8.06 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.82 (1H,d).
12	34	1.72 (3H,s); 1.73 (3H,s); 2.20 (3H,s); 3.39 (3H,s); 4.12 (2H,s); 5.56 (1H,s); 6.77 (1H,s); 7.22 (1H,dd); 7.58 (1H,m); 8.09 (1H,d); 8.92 (1H,s).
16	1	1.68 (6H,s); 1.83 (3H,s); 2.17 (3H,s); 3.83 (3H,s); 5.45 (1H,s); 6.59 (1H,bs); 6.79 (1H,t); 6.89 (2H,m).
16	48	1.61, 1.63, 1.65 和 1.66 (12H,4s); 1.81 和 1.82 (6H,2s); 2.69 和 2.79 (6H,2s); 3.83 和 3.84 (6H,2s); 5.20 和 5.42 (2H,2s); 6.66 和 6.83 (2H,2bs); 6.86 (1H,t); 6.92 (3H,m); 6.98 (2H,m).
16	95	1.65 (3H,s); 1.67 (3H,s); 1.81 (3H,s); 3.15 (3H,s); 3.83 (3H,s); 5.37 (1H,s); 6.83 (1H,s); 6.91 (1H,s); 6.93 (1H,s); 6.96 (1H,s).
17	1	1.68 (6H,s); 1.83 (3H,s); 2.17 (3H,s); 3.79 (3H,s); 5.43 (1H,s); 6.46 (1H,s); 6.63 (3H,s).

17	48	0.63, 1.65 和 1.66 (12H,3s); 1.80 和 1.82 (6H,2s); 2.68 和 2.76 (6H,2s); 3.78 和 3.79 (6H,2s); 5.17 和 5.38 (2H,2s); 6.54 (1H,t); 6.62 (1H,t); 6.67 (4H,m); 6.73 (1H,t); 6.82 (1H,bs).
17	95	1.66 (3H,s); 1.68 (3H,s); 1.82 (3H,s); 3.14 (3H,s); 3.80 (3H,s); 5.23 (1H,s); 6.58 (1H,s); 6.70 (3H,m).
21	20	1.68 (6H,s); 1.86 (2H,q); 2.22 (3H,s); 2.40 (2H,t); 3.66 (2H,t); 5.62 (1H,s); 6.68 (1H,s); 7.18 (1H,m); 7.48 (1H,dd); 8.04 (1H,d); 8.26 (1H,m); 8.82 (1H,d).
21	34	1.68 (6H,s); 1.82-1.90 (2H,m); 2.22 (3H,s); 2.40 (2H,t); 2.56 (2H,t); 5.54 (1H,s); 6.72 (1H,s); 7.24 (1H,dd); 7.58 (1H,d); 8.09 (1H,d); 8.92 (1H,s).
22	1	1.67 (3H,s); 1.68 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.15 (3H,s); 5.42 (1H,s); 6.69 (1H,bs); 6.95 (2H,d); 7.30 (2H,s).
23	1	1.60 (3H,s); 1.61 (3H,s); 1.75 (3H,s); 2.08 (3H,s); 5.36 (1H,s); 6.84 (2H,d); 7.36 (2H,s).
25	31	1.73 (6H,s); 2.17 (3H,s); 3.38 (3H,s); 4.12 (2H,s); 5.50 (1H,s); 6.63 (1H,bs); 7.38 (1H,t); 8.31 (1H,d); 8.33 (1H,d).
36	1	1.69 (3H,s); 1.70 (3H,s); 1.83 (3H,s); 2.16 (3H,s); 2.61 (3H,s); 5.55 (1H,s); 6.74 (1H,bs); 7.23 (1H,dd); 7.45 (1H,t); 7.62 (1H,m); 7.67 (1H,d).
38	1	1.68 (6H,2s); 1.81 (3H,s); 2.18 (3H,s); 5.48 (1H,s); 6.67 (1H,bs); 6.90 (1H,s); 6.96 (2H,m); 7.36 (1H,t).
42	1	1.68 (6H,s); 1.82 (3H,s); 2.17 (3H,s); 5.43 (1H,s); 6.57 (3H,m); 6.63 (1H,bs).
90	20	1.70 (6H,s); 1.95 (2H,q); 2.22 (3H,s); 2.40 (2H,t); 3.68 (2H,t); 5.62 (1H,s); 6.68 (1H,s); 7.18 (1H,m); 7.48 (1H,dd); 8.04 (1H,d); 8.26 (1H,m); 8.82 (1H,d).
90	34	1.68 (6H,s); 1.92-2.00 (2H,m); 2.20 (3H,s); 2.40 (2H,t); 3.66 (2H,t); 5.54 (1H,s); 6.72 (1H,s); 7.22-7.26 (1H,dd); 7.58 (1H,d); 8.09 (1H,d); 8.92 (1H,s).
91	31	1.68 (6H,s); 1.84 (3H,s); 2.18 (3H,s); 5.48 (1H,s); 6.62 (1H,bs); 7.52 (1H,m); 8.34 (1H,d); 8.42 (1H,m).
91	125	1.67 (3H,s); 1.68 (3H,s); 1.84 (3H,s); 3.18 (3H,s); 5.32 (1H,s); 6.82 (1H,s); 7.66 (1H,m); 8.44 (1H,s); 8.46 (1H,s).
135	1	1.67 (3H,s); 1.68 (3H,s); 1.82 (3H,s); 2.16 (3H,s); 2.36 (3H,s); 2.43 (3H,s); 5.43 (1H,s); 6.73 (1H,bs); 6.85 (2H,m); 7.17 (1H,d).
136	1	1.66 (3H,s); 1.67 (3H,s); 1.81 (3H,s); 2.15 (3H,s); 5.44 (1H,s); 6.70 (4H,m); 7.04 (2H,d); 7.14 (1H,t); 7.27 (2H,t); 7.36 (2H,t).
148	31	1.68 (3H,s); 1.70 (3H,s); 1.82-1.90 (2H,m); 2.16 (3H,s); 2.38-2.42 (2H,t); 2.54-2.58 (2H,t); 5.50 (1H,s); 6.62 (1H,s); 7.38 (1H,m); 8.31 (2H,m).
149	31	1.04 (3H,t); 1.62 (6H,s); 1.92-2.04 (4H,m); 2.38-2.42 (2H,t); 3.68 (2H,t); 4.46 (1H,t); 6.30 (1H,s); 7.26 (1H,m); 8.28 (2H,m).
319	125	1.68 (6H,s); 1.82 (3H,s); 3.18 (3H,s); 5.50 (1H,s); 7.18 (1H,s); 7.24 (1H,s); 8.06 (1H,s); 8.24 (1H,s).

實施例 34

本實施例說明式(1)化合物之殺真菌性質。

化合物係於葉圓盤檢驗中用以下所述之方法試驗。將試驗化合物溶解於 DMSO 中，並稀釋至水中到 200 ppm。在對終極腐霉試驗的情況中，它們係溶解於 DMSO 並稀釋至水中到 20 ppm。

大麥白粉病菌 (*Erysiphe graminis f. sp. hordei*) (大麥白粉病菌)：將大麥葉結置於 24 孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育四天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

小麥白粉病菌 (*Erysiphe graminis f. sp. tritici*) (小麥白粉病菌)：將小麥葉結置於 24 孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育四天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

小麥葉鏽病菌 (*Puccinia recondite f. sp. tritici*) (小麥棕鏽菌)：將小麥葉結置於 24 孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育九天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

小麥穎枯病菌 (小麥葉鏽病菌)：將小麥葉結置於 24

孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育四天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

圓核腔菌 (*Pyrenophora teres*) (大麥網斑病菌)：將大麥葉結置於 24 孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育四天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

稻熱病菌 (稻熱病菌)：將米葉結置於 24 孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育四天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

灰葡萄孢 (灰霉菌)：將大豆葉圓盤置於 24 孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育四天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

致病疫霉 (蕃茄上的馬鈴薯晚疫病菌)：將蕃茄葉圓盤置於 24 孔盤中的水瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育四天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

葡萄生單軸霉（葡萄藤露菌病菌）：將葡萄藤葉圓盤置於 24 孔盤中的瓊脂上，並用試驗化合物的溶液噴灑。在使其完全乾燥之後，大約 12 至 24 小時之間，將葉圓盤用真菌孢子懸浮劑播種。在適當培育之後，評估在培育七天之後的化合物活性，為預防性殺真菌活性。

終極腐霉（猝倒菌）：將製自新鮮液體培養之真菌菌絲片段混入馬鈴薯右旋糖湯中。將試驗化合物於二甲亞砜中之溶液用水稀釋到 20 ppm，然後置於 96 孔微量滴定盤中，並添加含有真菌孢子的養料湯。將試驗盤於 24°C 培育，並在 48 小時之後以光度測定生長抑制作用。

下列化合物（前面是化合物編號，括號內為表編號）對下列以 200 ppm 真菌的感染得到至少 60% 控制：

葡萄生單軸霉，化合物 2 (1)、2 (14)、2 (20)、2 (22)、2 (23)、2 (26)、2 (31)、2 (34)、2 (38)、2 (40)、2 (41)、2 (42)、2 (43)、3 (1)、3 (31)、3 (78)、4 (1)、4 (2)、4 (7)、4 (13)、4 (48)、4 (95)、4 (101)、9 (1)、12 (1)、12 (34)、16 (1)、16 (95)、17 (1)、21 (20)、21 (34)、22 (1)、23 (1)、25 (31)、38 (1)、42 (1)、90 (20)、90 (34)、91 (31)、148 (31)、149 (31)；

致病疫霉，化合物 2 (1)、2 (14)、2 (16)、2 (18)、2 (20)、2 (22)、2 (23)、2 (26)、2 (27)、2 (31)、2 (38)、2 (41)、2 (44)、3 (1)、3 (31)、3 (78)、4 (1)、4 (7)、4 (13)、4 (48)、4 (95)、4 (101)、9 (1)、12 (1)、12 (34)、16 (1)、16 (48)、17 (1)、21 (20)、21

(34)、22 (1)、23 (1)、25 (31)、38 (1)、42 (1)、90 (20)、90 (34)、91 (31)、131 (1)、148 (31)、149 (31) ;

小麥白粉病菌，化合物 2 (14)、2 (16)、2 (20)、2 (22)、2 (23)、2 (34)、3 (1)、4 (1)、4 (7)、9 (1)、12 (34)、16 (1)、16 (95)、17 (1)、21 (20)、38 (1)、90 (20)、90 (34)、91 (125) ;

稻熱病菌，化合物 2 (16)、2 (42)、17 (95) ;

灰葡萄孢，化合物 2 (1)、2 (22)、2 (27)、3 (1)、4 (1)、4 (101)、9 (1)、16 (95)、17 (1)、90 (34)、136 (1) ;

圓核腔菌，化合物 2 (16)、17 (48) ;

大麥白粉病菌，化合物 2 (1)、2 (14)、2 (16)、2 (20)、2 (22)、2 (23)、2 (26)、2 (44)、2 (81)、3 (1)、3 (78)、4 (1)、4 (2)、4 (7)、4 (48)、9 (1)、12 (1)、16 (1)、16 (95)、17 (1)、21 (20)、21 (34)、23 (1)、90 (20)、90 (34)、91 (31) ;

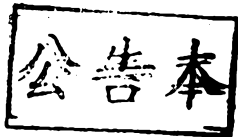
小麥葉鏽病菌，化合物 2 (16)、3 (1)、16 (95)、90 (34)、148 (31)、149 (31) ;

小麥穎枯病菌，化合物 21 (20)、90 (20) ;

下列化合物 (前面是化合物編號，括號內為表編號)
對下列以 20 ppm 真菌的感染得到至少 60% 控制：

終極腐霉，化合物 2 (1)、2 (14)、2 (16)、2 (18)、2 (20)、2 (22)、2 (23)、2 (26)、2 (27)、2 (31)、2

(34)、2 (38)、2 (41)、2 (42)、2 (44)、3 (1)、3 (31)
、3 (78)、4 (1)、4 (7)、4 (13)、4 (48)、4 (95)、4
(101)、9 (1)、12 (1)、12 (34)、16 (1)、17 (1)、21
(20)、21 (34)、22 (1)、23 (1)、25 (31)、36 (1)、38
(1)、42 (1)、90 (20)、90 (34)、91 (31)、135 (1)、148
(31)、149 (31)。



發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：93113305

※ 申請日期：93.5.12.

※IPC 分類：A01N 39/02

(2006.01)

壹、發明名稱：(中文/英文)

殺真菌劑 / FUNGICIDES

貳、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

先正達有限公司 / SYNGENTA LIMITED

代表人：(中文/英文)

喬瑟琳 塞若尼 / CERONI, JOCELYNE

住居所或營業所地址：(中文/英文)

英國沙伊郡 GU2 7YH 古得佛沙伊研究園區普里斯特里路先正達歐洲區中心

European Regional Centre, Priestley Road, Surrey Research Park, Guildford, Surrey GU2 7YH, UNITED KINGDOM

國 籍：(中文/英文)

英國 / UNITED KINGDOM

參、發明人：(共 5 人)

發明人 1

姓 名：(中文/英文)

派翠克 傑夫 克洛伊里 / CROWLEY, PATRICK JELF

住居所地址：(中文/英文)

先正達有限公司, 英國貝爾克郡 RG42 6EY 雷克內爾捷洛斯坡研究中心
Syngenta Limited, Jealotts Hill Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY, UK

國 籍：(中文/英文)

英國 / UNITED KINGDOM

發明人 2

姓 名：(中文/英文)

羅傑 賽門 / SALMON, ROGER

住居所地址：(中文/英文)

先正達有限公司, 英國貝爾克郡 RG42 6EY 雷克內爾捷洛斯坡研究中心
Syngenta Limited, Jealotts Hill Research Centre, Bracknell,
Berkshire RG42 6EY, UK

國 籍：(中文/英文)

英國 / UNITED KINGDOM

發明人 3

姓 名：(中文/英文)

歐利維亞 安娜貝勒 賽吉歐特 / SAGEOT, OLIVIA ANABELLE

住居所地址：(中文/英文)

先正達有限公司, 英國貝爾克郡 RG42 6EY 雷克內爾捷洛斯坡研究中心
Syngenta Limited, Jealotts Hill Research Centre, Bracknell,
Berkshire RG42 6EY, UK

國 籍：(中文/英文)

法國 / FRANCE

發明人 4

姓 名：(中文/英文)

大衛 飛利浦 貝肯 / BACON, DAVID PHILIP

住居所地址：(中文/英文)

先正達有限公司, 英國貝爾克郡 RG42 6EY 雷克內爾捷洛斯坡研究中心
Syngenta Limited, Jealotts Hill Research Centre, Bracknell,
Berkshire RG42 6EY, UK

國 籍：(中文/英文)

英國 / UNITED KINGDOM

發明人 5

姓 名：(中文/英文)

大衛 威廉 藍頓 / LANGTON, DAVID WILLIAM

住居所地址：(中文/英文)

先正達有限公司, 英國貝爾克郡 RG42 6EY 雷克內爾捷洛斯坡研究中心
Syngenta Limited, Jealotts Hill Research Centre, Bracknell,
Berkshire RG42 6EY, UK

國 籍：(中文/英文)

英國 / UNITED KINGDOM

肆、聲明事項：

本案係符合專利法第二十條第一項 第一款但書或 第二款但書規定之期間，其日期為： 年 月 日。

◎本案申請前已向下列國家（地區）申請專利 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 英國；2003.06.04.；0312863.4

2.

3.

4.

5.

主張國內優先權（專利法第二十五條之一）：

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

1.

2.

主張專利法第二十六條微生物：

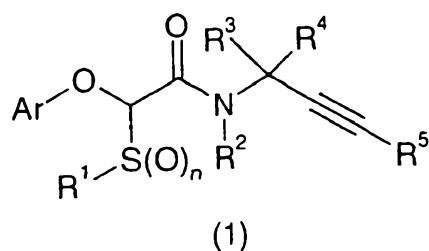
國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

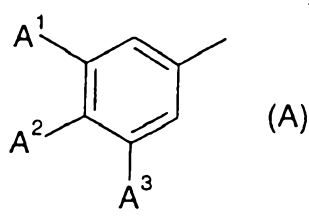
熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

伍、中文發明摘要：

通式(1)之殺真菌化合物：

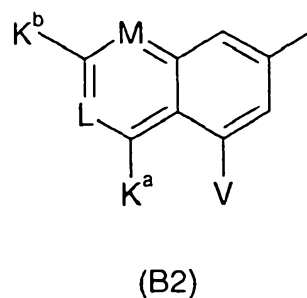
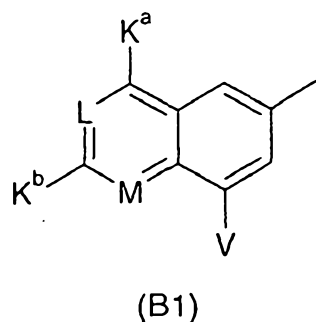


其中 Ar 是一種式(A)之基團：



其中 A^1 、 A^2 和 A^3 係獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基、 C_{2-4} 烯基、鹵素(C_{2-4})烯基、 C_{2-4} 炔基、鹵素(C_{2-4})炔基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 $-S(O)_m(C_{1-4})$ 烷基，其中 m 是 0、1 或 2 且烷基係視需要經鹵素取代， $-OSO_2(C_{1-4})$ 烷基，其中烷基係視需要經鹵素取代，氰基、硝基、 C_{1-4} 烷氧羰基、 $-CONR^mR^n$ 、 $-COR^m$ 、 $-NR^mCOR^n$ 、 $-SO_2NR^mR^n$ 或 $-NR^mSO_2R^1$ ，其中 R^1 是 C_{1-4} 烷基，而 R^m 和 R^n 係獨立地為 H 或 C_{1-4} 烷基；或者

Ar 是一種式(B1)或(B2)之基團：



其中 L 和 M 係獨立地為 N、N-氧化物或 CQ，但是 L 或 M 不超過一者是 N-氧化物；

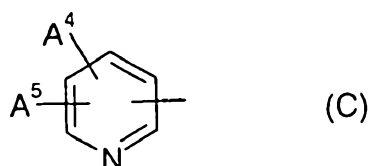
K^a 和 K^b 係獨立地為 H 或 F；

V 是：H，鹵素，視需要經鹵素或 C_{1-4} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷基，視需要經鹵素或 C_{1-4} 烷氧基取代之 C_{3-6} 環烷基，視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 烯基，視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 炔基，視需要經鹵素或 C_{1-4} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷氧基，視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 烯氧基，視需要經鹵素取代之 C_{2-4} 炔氧基，氰基、硝基、 C_{1-4} 烷氧羰基、 $-OSO_2R'$ ； $-S(O)_mR'$ 、 $-COR''$ 、 $-CONR''R'''$ 、 $-SO_2NR''R'''$ 、 $-NR''SO_2R'$ 、 $-CR''=NR'''$ 、 $-NR''R'''$ 、 $-NR''COR'''$ 、 $-NR''CO_2R'''$ ，其中 m 是 0、1 或 2， R' 是視需要經鹵素取代之 C_{1-6} 烷基，而 R'' 和 R''' 係獨立地為 H 或 C_{1-6} 烷基，或者在 $-CONR''R'''$ 或 $-SO_2NR''R'''$ 的情況中，可結合形成一個含有一個氮原子、數個飽和碳原子和視需要一個氧原子的 5 或 6 員環；

Q 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、鹵素(C_{1-8})烷基、鹵素(C_{1-8})烷氧基、鹵素(C_{1-8})烷硫基、硝基、胺基、單或二(C_{1-6})烷基胺基、單或二(C_{2-6})烯基胺基、單或二(C_{2-6})炔基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷氧羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺羰基、單或二(C_{1-4})烷基胺羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰氧基、芳基(C_{1-4})烷羰氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基磺醯氧基、鹵

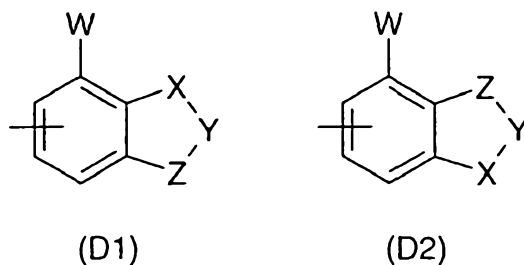
素 (C_{1-4}) 烷基亞磺醯基、鹵素 (C_{1-4}) 烷基磺醯基、 $-SO_2NR^mR^n$ 、 $-NR^mSO_2R^1$ ，其中 R^1 是視需要經鹵素取代之 C_{1-6} 烷基，而 R^m 和 R^n 係獨立地為 H 或 C_{1-6} 烷基，或者，在 $-SO_2NR^mR^n$ 的情況中，可結合形成一個含有一個氮原子、數個飽和碳原子和視需要一個氧原子的 5 或 6 員環；或者

Ar 是一種式 (C) 之基團：



其中 A^4 和 A^5 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、硝基、胺基、單或二 (C_{1-6}) 烷基胺基、單或二 (C_{2-6}) 烯基胺基、單或二 (C_{2-6}) 炔基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基 (甲醯基) 胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷基 (C_{1-4} 烷羰基) 胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺羰基、單或二 (C_{1-4}) 烷基胺羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰氧基、芳基 (C_{1-4}) 烷羰氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯氧基、芳基、雜芳基、芳氧基、芳硫基、雜芳氧基或雜芳硫基，其中前述之烷基、環烷基、烯基、炔基、芳基或雜芳基等基團或部分係視需要經取代；或者

Ar 是一個式 (D1) 或 (D2) 之 5-或 6-連接基：



其中 W 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基、氰基或硝基，

X 是 N、NH 或 $N-C_{1-4}$ 烷基，

Y 是 CR、N、NH、 $N-C_{1-4}$ 烷基、O 或 S，

Z 是 CR、N、NH、 $N-C_{1-4}$ 烷基、O 或 S，

R 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基或鹵素(C_{1-4})烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基亞磺醯基、鹵素(C_{1-4})烷基磺醯基或單或二(C_{1-6})烷基胺基，結合 X、Y、Z 和稠合苯環的鍵結為適合 X、Y 和 Z 價數的雙鍵或單鍵，但前提是 Y 和 Z 中只有一個可為 O 或 S，Y 和 Z 中只有一個可為 CH 或 CR，以及 X、Y 和 Z 中只有一個可為 NH 或 $N-C_{1-4}$ 烷基；

R^1 是甲基或乙基；

R^2 是 H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部分的苯環係視需要經 C_{1-4} 烷氧基取代；

R^3 和 R^4 係獨立地為 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，但前提是二者不同時為 H，且當二者都不是 H 時，它們的總合碳數不超過 4，或者

R^3 和 R^4 與它們所連接的碳原子結合形成一個 3 或 4 員碳環族環，其視需要含有一個 O、S 或 N 原子且視需要鹵素或 C_{1-4} 烷基取代；

R^5 是：H， C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中該烷基或環烷基係視需要經鹵素、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 烷羰氧基、胺基羰氧基或單或二(C_{1-4})烷胺基羰氧基取代， $-S(O)_p(C_{1-6})$ 烷基，其中 p 是 0、1 或 2，三唑基，吡唑基，咪唑基，三(C_{1-4})-烷基甲矽烷氧基，視需要經取代之苯氧基，視需要經取代之噻吩氧基，視需要經取代之呋氧基或視需要經取代之噻吩甲氧基，或者

R^5 是視需要經取代之苯基、視需要經取代之噻吩基或視需要經取代之呋基，

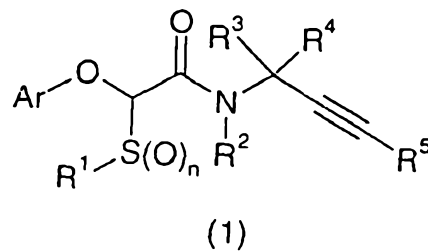
其中該 R^5 等值物之視需要經取代之苯基和噻吩基環或部分係視需要經一、二或三個選自於下列之取代基取代：鹵素、羥基、巰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{2-4} 烯氧基、 C_{2-4} 炔氧基、鹵素(C_{1-4})烷基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷硫基、鹵素(C_{1-4})烷基、羥基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯氧基、呋氧基、苯甲醯氧基、氰基、異氰基、硫氰基、異硫氰基、硝基、 $-NR^pR^q$ 、 $-NHCOR^p$ 、 $-NHCONR^pR^q$ 、 $-CONR^pR^q$ 、 $-SO_2R^o$ 、 $-OSO_2R^o$ 、 $-COR^p$ 、 $-CR^p=NR^q$ 或 $-N=CR^pR^q$ ，其中 R^o 是 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或呋基，該苯基和呋基係視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代，而 R^p 和 R^q 係獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基

、苯基或苄基，該苯基和苄基係視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代；以及

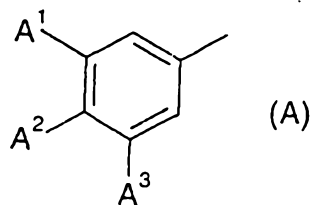
n 是 0、1 或 2。

陸、英文發明摘要：

Fungicidal compounds of the general formula (1):

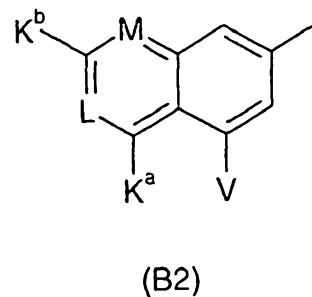
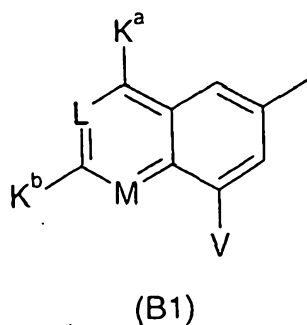


wherein Ar is a group of the formula (A):



wherein A^1 , A^2 and A^3 are independently H, halogen, C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{2-4} alkenyl, halo(C_{2-4})alkenyl, C_{2-4} alkynyl, halo(C_{2-4})alkynyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, $-S(O)_m(C_{1-4})$ alkyl wherein m is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, $-OSO_2(C_{1-4})$ alkyl where the alkyl group is optionally substituted with halo, cyano, nitro, C_{1-4} alkoxy, $-CONR^mR^n$, $-COR^m$, $-NR^mCOR^n$, $-SO_2NR^mR^n$ or $-NR^mSO_2R^1$ where R^1 is C_{1-4} alkyl and R^m and R^n are independently H or C_{1-4} alkyl; or

Ar is a group of the formula (B1) or (B2):



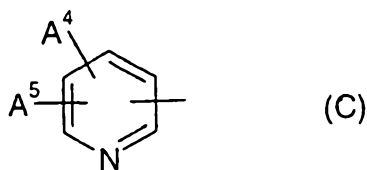
wherein L and M are independently N, N-oxide or CQ, except that no more than one of L or M is N-oxide;

K^a and K^b are independently H or F;

V is H, halo, C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkoxy, C₃₋₆ cycloalkyl optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkoxy, C₂₋₄ alkenyl optionally substituted with halo, C₂₋₄ alkynyl optionally substituted with halo, C₁₋₆ alkoxy optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkoxy, C₂₋₄ alkenyloxy optionally substituted with halo, C₂₋₄ alkynyloxy optionally substituted with halo, cyano, nitro, C₁₋₄ alkoxycarbonyl, -OSO₂R', -S(O)_mR', -COR'', -CONR''R''', -SO₂NR''R''', -NR''SO₂R', -CR''=NR''', -NR''R''', -NR''COR''', -NR''CO₂R''' where m is 0, 1 or 2, R' is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen and R'' and R''' are independently H or C₁₋₆ alkyl or, in the case of -CONR''R'''' or -SO₂NR''R''', may join to form a 5- or 6-membered ring containing a single nitrogen atom, saturated carbon atoms and optionally a single oxygen atom;

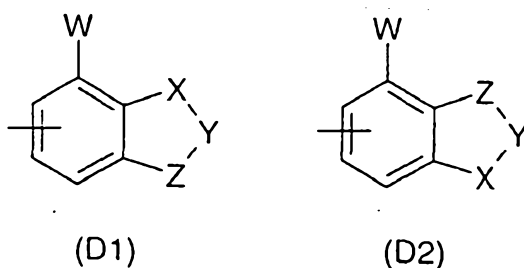
Q is H, halo, C₁₋₈ alkyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₂₋₈ alkenyl, C₂₋₈ alkynyl, C₁₋₈ alkoxy, C₁₋₈ alkylthio, halo(C₁₋₈)alkyl, halo(C₁₋₈)alkoxy, nitro, amino, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino, mono- or di-(C₂₋₆)alkenylamino, mono- or di-(C₂₋₆)alkynylamino, formylamino, C₁₋₄ alkyl(formyl)amino, C₁₋₅ alkyl carbonylamino, C₁₋₄ alkoxycarbonylamino, C₁₋₄ alkyl(C₁₋₄ alkylcarbonyl)amino, cyano, formyl, C₁₋₄ alkylcarbonyl, C₁₋₄ alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, mono- or di-(C₁₋₄)alkylaminocarbonyl, carboxy, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aryl(C₁₋₄)alkylcarbonyloxy, C₁₋₄ alkylsulphinyl, C₁₋₄ alkylsulphonyl or C₁₋₄ alkylsulphonyloxy, halo(C₁₋₄)alkylsulphinyl, halo(C₁₋₄)alkylsulphonyl or halo(C₁₋₄)alkylsulphonyloxy, -SO₂NR^mRⁿ, -NR^mSO₂R^l, where R^l is C₁₋₆ alkyl and R^m and Rⁿ are independently H or C₁₋₆ alkyl or, in the case of -SO₂NR^mRⁿ, may join to form a 5- or 6-membered ring containing a single nitrogen atom, saturated carbon atoms and optionally a single oxygen atom; or

Ar is a group of the formula (C):



wherein A^4 and A^5 are independently H, halo, C_{1-8} alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{2-8} alkenyl, C_{2-8} alkynyl, C_{1-8} alkoxy, C_{1-8} alkylthio, nitro, amino, mono- or di- (C_{1-6}) alkylamino, mono- or di- (C_{2-6}) alkenylamino, mono- or di- (C_{2-6}) alkynylamino, formylamino, C_{1-4} alkyl(formyl)amino, C_{1-4} alkylcarbonylamino, C_{1-4} alkyl(C_{1-4} alkylcarbonyl)amino, cyano, formyl, C_{1-4} alkylcarbonyl, C_{1-4} alkoxy, aminocarbonyl, mono- or di- (C_{1-4}) alkylaminocarbonyl, carboxy, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aryl($C_{1-4})$ alkylcarbonyloxy, C_{1-4} alkylsulphinyl, C_{1-4} alkylsulphonyl, C_{1-4} alkylsulphonyloxy, aryl, heteroaryl, aryloxy, arylthio, heteroaryloxy or heteroarylthio wherein any of the foregoing alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, groups or moieties are optionally substituted; or

Ar is a 5- or 6- linked group of the formula (D1) or (D2):



wherein W is H, halo, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{1-4} alkylsulphinyl, C_{1-4} alkylsulphonyl, halo($C_{1-4})$ alkyl, halo($C_{1-4})$ alkoxy, halo($C_{1-4})$ alkylthio, halo($C_{1-4})$ alkylsulphinyl, halo($C_{1-4})$ alkylsulphonyl, cyano or nitro,

X is N, NH or N- C_{1-4} alkyl,

Y is CR, N, NH, N- C_{1-4} alkyl, O or S,

Z is CR, N, NH, N- C_{1-4} alkyl, O or S,

R is H, halo, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ alkylsulphinyl, C₁₋₄ alkylsulphonyl, halo(C₁₋₄)alkyl or halo(C₁₋₄)alkoxy, halo(C₁₋₄)alkylthio, halo(C₁₋₄)alkylsulphinyl, halo(C₁₋₄)alkylsulphonyl or mono- or di-(C₁₋₄)alkylamino,

the bonds joining X, Y, Z and the fused benzene ring are double or single bonds appropriate to the valencies of X, Y and Z, provided that only one of Y and Z may be O or S, that only one of Y and Z may be CH or CR and that only one of X, Y and Z may be NH or N-C₁₋₄ alkyl;

R¹ is methyl or ethyl;

R² is H, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxymethyl or benzyloxymethyl in which the phenyl ring of the benzyl moiety is optionally substituted with C₁₋₄ alkoxy;

R³ and R⁴ are independently H, C₁₋₃ alkyl, C₂₋₃ alkenyl or C₂₋₃ alkynyl provided that both are not H and that when both are other than H their combined total of carbon atoms does not exceed 4, or

R³ and R⁴ join with the carbon atom to which they are attached to form a 3 or 4 membered carbocyclic ring optionally containing one O, S or N atom and optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkyl;

R⁵ is H, C₁₋₄ alkyl or C₃₋₆ cycloalkyl in which the alkyl or cycloalkyl group is optionally substituted with halo, hydroxy, C₁₋₆ alkoxy, cyano, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy or mono- or di-(C₁₋₄)alkylaminocarbonyloxy, -S(O)_p(C₁₋₆)alkyl where p is 0, 1 or 2, triazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, tri(C₁₋₄)-alkylsilyloxy, optionally substituted phenoxy, optionally substituted thienyloxy, optionally substituted benzyloxy or optionally substituted thienylmethoxy, or

R⁵ is optionally substituted phenyl, optionally substituted thienyl or optionally substituted benzyl,

in which the optionally substituted phenyl and thienyl rings or moieties of the R⁵ values are

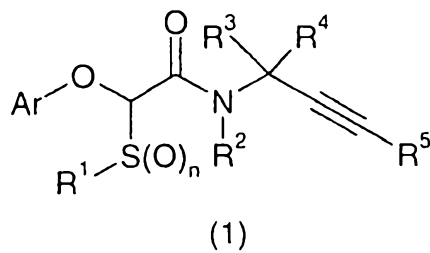
optionally substituted with one, two or three substituents selected from halo, hydroxy, mercapto, C₁₋₄ alkyl, C₂₋₄ alkenyl, C₂₋₄ alkynyl, C₁₋₄ alkoxy, C₂₋₄ alkenyloxy, C₂₋₄ alkynyloxy, halo(C₁₋₄)alkyl, halo(C₁₋₄)alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, halo(C₁₋₄)alkylthio, hydroxy(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, phenoxy, benzyloxy, benzoyloxy, cyano, isocyano, thiocyanato, isothiocyanato, nitro, -NR^pR^q, -NHCOR^p, -NHCONR^pR^q, -CONR^pR^q, -SO₂R^o, -OSO₂R^o, -COR^p, -CR^p=NR^q or -N=CR^pR^q, in which R^o is C₁₋₄ alkyl, halo(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy, halo(C₁₋₄)alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ alkoxy and R^p and R^q are independently hydrogen, C₁₋₄ alkyl, halo(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy, halo(C₁₋₄)alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ alkoxy; and n is 0, 1 or 2.

公告本

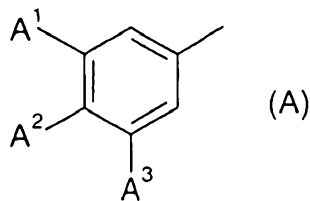
拾、申請專利範圍：

99年2月4日修(更)正本

1. 一種通式(1)之化合物，

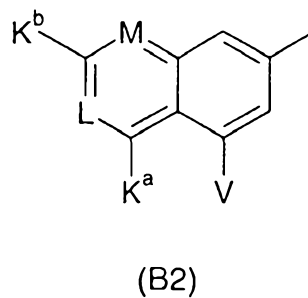
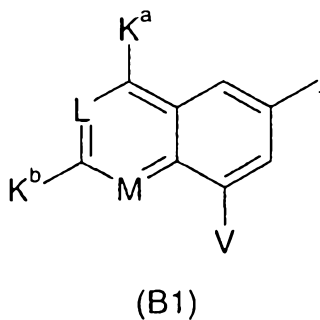


其中 Ar 是式(A)之基團：



其中 A^1 、 A^2 和 A^3 係獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、鹵素(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素(C_{1-4})烷氧基或 $-S(O)_m(C_{1-4})$ 烷基，其中 m 是 0；或者

Ar 是式(B1)或(B2)之基團：



其中 L 和 M 係獨立地為 N、N-氧化物或 CQ，惟 L 或 M 不超過一者是 N-氧化物；

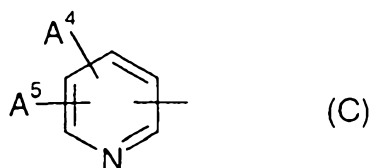
K^a 和 K^b 為 H；

V 是 H、鹵素或 C_{1-6} 烷基；

Q 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基或鹵素(C_{1-8})烷

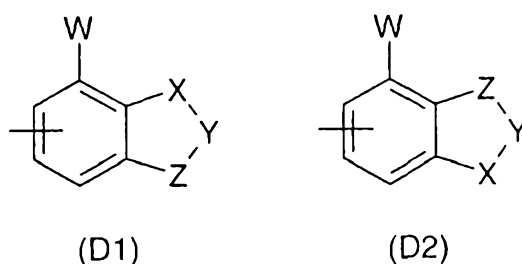
基；或者

Ar 是式 (C) 之基團：



其中 A^4 和 A^5 係獨立地為 H 或鹵素；或者

Ar 是式 (D1) 或 (D2) 之 5-或 6-連接基：



其中 W 是 H、鹵素或 C_{1-4} 烷基，

X 是 N 或 $N-C_{1-4}$ 烷基，

Y 是 CR、N 或 O，

Z 是 CR、N、 $N-C_{1-4}$ 烷基、O 或 S，

R 是 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或單(C_{1-4})烷基胺基，結合 X、Y、Z 和稠合苯環的鍵結為適合 X、Y 和 Z 價數的雙鍵或單鍵，但前提是 Y 和 Z 中只有一個可為 O，Y 和 Z 中只有一個可為 CH 或 CR，以及 X 和 Z 中只有一個可為 $N-C_{1-4}$ 烷基；

R^1 是甲基或乙基；

R^2 是 H；

R^3 和 R^4 係獨立地為 C_{1-3} 烷基，但前提是它們的總合碳數不超過 4，或者

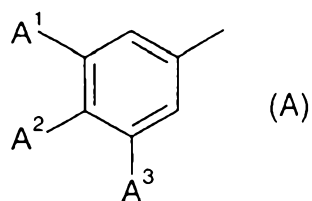
R^3 和 R^4 與它們所連接的碳原子結合形成一個 3 或 4 員碳環族環；

R^5 是 H 或 C_{1-4} 烷基，其中該烷基係視需要經鹵素、羥基、 C_{1-6} 烷氧基或氰基取代，或者

R^5 是視需要經取代之苯基或視需要經取代之噻吩基，其中該 R^5 等值物之視需要經取代之苯基和噻吩基環或部分係視需要經一、二或三個選自於鹵素、羥基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、氰基或硝基之取代基取代；以及

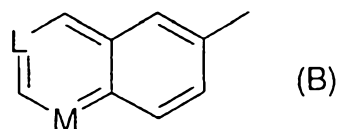
n 是 0、1 或 2。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是式 (A) 之基團：



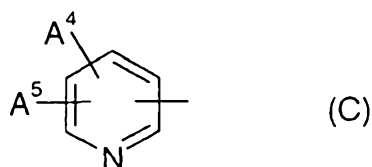
其中 A^1 、 A^2 和 A^3 係獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基、鹵素 (C_{1-4}) 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵素 (C_{1-4}) 烷氧基或 $-S(O)_m(C_{1-4})$ 烷基，其中 m 是 0；或者

Ar 是式 (B) 之基團：



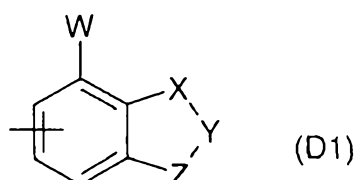
其中 L 和 M 其中之一為 N，而另一者為 CQ；Q 是 H、鹵素、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基或鹵素 (C_{1-8}) 烷基；或者

Ar 是式 (C) 之基團：



其中 A^4 和 A^5 係獨立地為 H 或鹵素；或者

Ar 是式 (D1) 之 5-或 6-連接基團：



其中 W 是 H、鹵素或 C_{1-4} 烷基，

X 是 N 或 $N-C_{1-4}$ 烷基，

Y 是 CH、N 或 O，

Z 是 CH、N、 $N-C_{1-4}$ 烷基、O 或 S，以及

結合 X、Y、Z 和稠合苯環的鍵結為適合 X、Y 和 Z 價數的雙鍵或單鍵，但前提是 Y 和 Z 中只有一個可為 O，Y 和 Z 中只有一個可為 CH，以及 X 和 Z 中只有一個可為 $N-C_{1-4}$ 烷基；

R^1 是甲基或乙基；

R^3 和 R^4 係獨立地為 C_{1-3} 烷基，但前提是它們的總合碳數不超過 4，或者

R^3 和 R^4 與它們所連接的碳原子結合形成一個 3 或 4 員碳環族環；

R^5 是 H 或 C_{1-4} 烷基，其中該烷基係視需要經鹵素、羥基、 C_{1-6} 烷氧基或氰基取代，或者

R^5 是視需要經取代之苯基或視需要經取代之噻吩基，

其中該 R^5 等值物之視需要經取代之苯基和噻吩基環係視需要經一、二或三個選自於鹵素、羥基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、氰基或硝基之取代基取代；以及

n 是 0、1 或 2。

3. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式(A)之基團，其中 A^1 、 A^2 和 A^3 都是氯或甲基；或者 A^1 和 A^3 二者為氯、溴或氟，而 A^2 是 H 或甲基；或者 A^1 和 A^3 二者為甲基或甲氧基，而 A^2 是 H、氯、溴或烷硫基；或者 A^1 是甲氧基， A^2 是 H，而 A^3 是氯；或者 A^1 是甲基， A^2 是 H，而 A^3 是乙基；或者 A^1 是氯、溴、三氯甲基或三氯甲氧基，而 A^2 和 A^3 二者為 H；或者 A^1 和 A^3 二者為 H，而 A^2 是氯或溴；或者 A^1 是甲基， A^2 是烷硫基，而 A^3 是 H。

4. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式(B1)或(B2)之基團，其中 M 是 N 且 L 是 CQ，或者 L 和 M 二者都是 N，或者 L 是 N 且 M 是 CQ，或者 L 和 M 二者都是 CQ，而 Q 是 H 或鹵素。

5. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式(C)之吡啶基團，且在通式(1)化合物中之烷酸醯胺側鏈係於 3-位連接至吡啶環。

6. 根據申請專利範圍第 5 項之化合物，其中在式(C)之基團中， A^4 是 H，而 A^5 是鹵素。

7. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式(D1)或(D2)之基團，其中 W 是 H、鹵素或 C_{1-4} 烷基，以

及

(1) X 是 N，Y 是 CR，Z 是 O、S 或 N-C₁₋₄ 烷基，且 R 是 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基或單或二(C₁₋₄)烷基胺基，X-Y 鍵為雙鍵，而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵；或者

(2) X 和 Y 是 N，且 Z 是 O、S 或 N-C₁₋₄ 烷基，X-Y 鍵為雙鍵，而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵；或者

(3) X 是 N，Y 是 O，Z 是 CR，且 R 是 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基或單(C₁₋₄)烷基胺基，X-Y 鍵和 Y-Z 鍵為單鍵，而將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為雙鍵；或者

(4) X 是 N-C₁₋₄ 烷基，Y 是 N，Z 是 CR，且 R 是 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基或單(C₁₋₄)烷基胺基，Y-Z 鍵為雙鍵，而 Y-Z 鍵及將 X 和 Z 結合至苯環的鍵結為單鍵。

8. 根據申請專利範圍第 7 項之化合物，其中該式(D1)或(D2)之基團為：視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-和 6-苯并噻唑基，視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-和 6-(2,1-苯并異噻唑基)，視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-和 6-苯并噁唑基，視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-和 6-(2,1-苯并異噁唑基)，視需要帶有一個 2-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-苯并咪唑基)，視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-吡啶基)，視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(2H-吡啶基)，5-和 6-

(1,2,3-苯并噻二唑基)，5-和 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)，視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-和 6-(1H-苯并三唑基)，視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-(2H-苯并三唑基)，5-(2,1,3-苯并噻二唑基)及 5-(2,1,3-苯并噁二唑基)，其中前述視需要選用的取代基任一者係選自於鹵素或 C₁₋₄ 烷基。

9. 根據申請專利範圍第 7 項之化合物，其中該式 (D1) 或 (D2) 之基團為：視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-或 6-苯并噻唑基，視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-(2,1-苯并異噻唑基)，視需要帶有一個 2-C 取代基之 6-苯并噁唑基，視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-(2,1-苯并異噁唑基)，視需要帶有一個 2-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 6-(1H-苯并咪唑基)，視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 N-C₁₋₄ 烷基取代基之 5-(1H-噁唑基)，6-(1,2,3-苯并噻二唑基)或 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)，其中前述視需要選用的取代基任一者係選自於鹵素或 C₁₋₄ 烷基。

10. 根據申請專利範圍第 1 至 9 項中任一項之化合物，其中 R³ 和 R⁴ 二者為甲基。

11. 根據申請專利範圍第 1 至 9 項中任一項之化合物，其中 R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯基正丙基、苯基、4-氟苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基。

12. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R³ 和 R⁴ 二者為甲基；且 R⁵ 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-

甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、4-氟苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基。

13.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式(A)之基團，其中 A^1 、 A^2 和 A^3 都是氟或甲基，或者 A^1 和 A^3 二者為氟、溴或氯，而 A^2 是 H 或甲基，或者 A^1 和 A^3 二者為甲基或甲氧基，而 A^2 是 H、氟、溴或烷硫基，或者 A^1 是甲基， A^2 是 H，而 A^3 是乙基，或者 A^1 是氟、溴、三氟甲基或三氟甲氧基，而 A^2 和 A^3 二者為 H，或者 A^1 和 A^3 二者為 H，而 A^2 是氟或溴，或者 A^1 是甲基， A^2 是烷硫基，而 A^3 是 H； R^3 和 R^4 二者為甲基；且 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、4-氟苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基。

14.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式(B1)或(B2)之基團，其中 L 和 M 係獨立地為 N、N-氧化物或 CQ，惟 L 或 M 中不超過一者是 N-氧化物；Q 是 H 或鹵素； R^3 和 R^4 二者為甲基；且 R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基。

15.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式(C)之基團，其中 A^4 是 H；而 A^5 是鹵素； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氟基正丙基、3-氯正丙基、苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基。

16. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式 (C) 之基團，其中 A^4 是 H； A^5 是 H 或鹵素； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氯基正丙基、3-氯正丙基、苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基；以及烷酸醯胺側鏈係連接至吡啶環之 3-位。

17. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是一種式 (C) 之基團，其中 A^4 是 H； A^5 是 H 或鹵素； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氯基正丙基、3-氯正丙基、苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基；以及烷酸醯胺側鏈係連接至吡啶環之 4-位。

18. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 是視需要帶有一個 2-C 取代基之 5-或 6-苯并噻唑基、視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-(2,1-苯并異噻唑基)、視需要帶有一個 2-C 取代基之 6-苯并噁唑基、視需要帶有一個 3-C 取代基之 5-(2,1-苯并異噁唑基)、視需要帶有一個 2-C 取代基且視需要帶有一個 N- C_{1-4} 烷基取代基之 6-(1H-苯并咪唑基)、視需要帶有一個 3-C 取代基且視需要帶有一個 N- C_{1-4} 烷基取代基之 5-(1H-噁唑基)、6-(1,2,3-苯并噻二唑基) 或 6-(1,2,3-苯并噁二唑基)，其中前述視需要選用的取代基任一者係選自於鹵素或 C_{1-4} 烷基； R^3 和 R^4 二者為甲基； R^5 是 H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、3-氯基正丙基、3-氯正丙基、苯基、噻吩-2-基或噻吩-3-基。

19. 一種殺真菌組成物，其包含殺真菌上有效量之根據申請專利範圍第 1 項之式 (1) 化合物及其適當載劑或稀釋劑

20. 一種對抗或控制植物病原真菌之方法，其包括將殺真菌上有效量之根據申請專利範圍第 1 項之式(1)化合物或根據申請專利範圍第 19 項之組成物施用於植物、植物種子、植物或種子的所在地或土壤或任何其他植物生長媒質上。

拾壹、圖式：

(無)

柒、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第(無)圖。

(二)本代表圖之元件代表符號簡單說明：

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

